



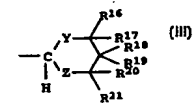
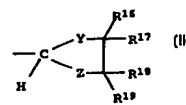
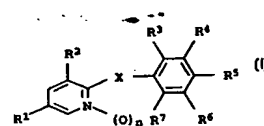
(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : C07D 213/61, A01N 43/40	A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 98/42671 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 1. Oktober 1998 (01.10.98)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP98/01354 (22) Internationales Anmeldedatum: 9. März 1998 (09.03.98) (30) Prioritätsdaten: 197 11 569.1 20. März 1997 (20.03.97) DE (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AK- TIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE). (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstrasse 1, D-67308 Ottersheim (DE). HAM- PRECHT, Gerhard [DE/DE]; Rote-Turm-Strasse 28, D-69469 Weinheim (DE). MENGES, Markus [DE/DE]; Jacob-Löhr-Strasse 18, D-64625 Bensheim (DE). MENKE, Olaf [DE/DE]; Lerchenweg 3, D-67317 Al- tleiningen (DE). RACK, Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, D-69123 Heidelberg (DE). ZAGAR, Cyrill [DE/DE]; Georg-Herwegh-Strasse 31, D-67061 Ludwigshafen (DE). WESTPHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Mausbergweg 58, D-67346 Speyer (DE). MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Man- delring 74, D-67433 Neustadt (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Grünstadter Strasse 82, D-67283 Obrigheim (DE).		(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE). (81) Bestimmungsstaaten: AL, AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, GE, HU, ID, IL, JP, KR, KZ, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, US, VN, eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Veröffentlicht Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.

(54) Title: SUBSTITUTED 2-BENZ(O)YLPYRIDINES, THEIR PREPARATION AND THEIR USE AS HERBICIDES

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE 2-BENZ(O)YLPYRIDIN DERIVATE, DEREN HERSTELLUNG UND DEREN VERWENDUNG
ALS HERBIZIDE

(57) Abstract

Substituted 2-benz(o)ylpyridines of formula (I) and the salts thereof, wherein n = 0, 1;
 x = CO, CH₂, CH(C₁-C₄-alkyl), CH-OH, CH-CN, CH-halogen, C(halogen)₂, CH-CONH₂,
 CH-CO-O(C₁-C₄-alkyl), CH-O(C₁-C₄-alkyl), C(CN) (C₁-C₄-alkyl); R¹ = halogen,
 C₁-C₄-halogen alkane, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-alkyl sulfinyl, C₁-C₄-alkyl sulfonyl; R²
 = H, halogen; R³ = H, NO₂, OH, halogen, C₁-C₄-alkoxy; R⁴ = H, NO₂, OH, halogen,
 C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogen alkane, C₁-C₄-alkoxy; R⁵ = H, NO₂, CN, halogen, C₁-C₈-alkyl,
 C₃-C₈-alkenyl, C₃-C₈-alkinyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₈-halogen alkane, C₂-C₈-halogen
 alkenyl, C₂-C₈-halogen alkane, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl-C₁-C₄-alkyl,
 C₂-C₄-alkenyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,
 cyano-C₁-C₈-alkyl, cyano-C₂-C₈-alkenyl, cyano-C₃-C₈-alkinyl, optionally substituted OH, SH, SO-H, -SO₂-H, COOH or
 NH-COOH, -SO₂Cl, -N(R⁹, R¹⁰), -NH-SO₂-(C₁-C₈-alkyl), -N[-SO₂-(C₁-C₈-alkyl)]₂, -N(C₁-C₈-alkyl) [-SO₂-(C₁-C₈-alkyl)],
 -SO₂-N(R⁹, R¹⁰), -O-CO-NH-R⁹, optionally substituted CHO, -O-CHO or -NH-CHO, NH-CO-NH-R⁹, -O-CS-NH₂,
 -OCS-N(C₁-C₈-alkyl)₂, -CO-N(R⁹, R¹⁰), -CS-N(R⁹, R¹⁰), -CO-NH-SO₂-(C₁-C₄-alkyl), -CO-N(C₁-C₄-alkyl), -SO₂-(C₁-C₄-alkyl),
 hydroxycarbonyl-C₁-C₈-alkyl, (C₁-C₈-alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, -CH₂-CH(halogen)-CO-N(R⁹, R¹⁰), -CH₂-CH(halogen)-CN,
 -CH₂-CH(halogen)-CO-(C₁-C₄-alkyl), optionally substituted -CH₂-CH(halogen)-COOH, -CH=C(halogen)-COOH or
 -CH=C(C₁-C₄-alkyl)-COOH, optionally substituted -CH=N-OH or -CH(-Y-R¹⁵, -Z-R¹⁵), (II) or (III); R⁹, R¹⁰ = H, C₁-C₈-alkyl,
 C₃-C₈-cycloalkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₃-C₈-alkinyl, C₁-C₈-halogen alkane, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, cyano-C₁-C₈-alkyl, hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 (C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₃-C₆-cycloalkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₃-C₇-cycloalkyl,
 C₁-C₄-alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, optionally substituted phenyl or phenyl-C₁-C₄-alkyl or R⁹ +
 R¹⁰ together = optionally substituted tetramethylene, pentamethylene or ethylene oxyethylene chain; Y, Z = O, S; R¹⁵ = C₁-C₈-alkyl,
 C₁-C₈ halogen alkane, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl; R¹⁶-R²¹ = H, CN, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₈-alkoxy,
 C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, COOH, (C₁-C₈-alkoxy)carbonyl, CONH₂, (C₁-C₈-alkyl)aminocarbonyl, di(C₁-C₈-alkyl)aminocarbonyl; R⁶
 = H, NO₂, halogen, optionally substituted OH or COOH; R⁷ = H, NO₂, halogen, optionally substituted OH; excluding those compounds in
 (I) in wherein X = CH₂ and R⁵ = optionally substituted OH as well as R³, R⁷ = H or R¹ = halogen as well as R³, R⁴, R⁶, R⁷ = H. The
 invention further relates to the use of said substances as herbicides and for dessication/defoliation of plants.



(57) Zusammenfassung

Substituierte 2-Benz(o)ylpyridine der Formel (I) und deren Salze, wobei $n = 0, 1$; $x = \text{CO}, \text{CH}_2, \text{CH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}), \text{CH-OH}, \text{CH-CN}, \text{CH-Halogen}, \text{C}(\text{Halogen})_2, \text{CH-CONH}_2, \text{CH-CO-O}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}), \text{CH-O}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}), \text{C}(\text{CN}) (\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl})$; $\text{R}^1 = \text{Halogen}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Halogenalkyl}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylthio}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylsulfinyl}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylsulfonyl}$; $\text{R}^2 = \text{H}, \text{Halogen}$; $\text{R}^3 = \text{H}, \text{NO}_2, \text{OH}, \text{Halogen}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy}$; $\text{R}^4 = \text{H}, \text{NO}_2, \text{OH}, \text{Halogen}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Halogenalkyl}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy}$; $\text{R}^5 = \text{H}, \text{NO}_2, \text{CN}, \text{Halogen}, \text{C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl}, \text{C}_3\text{-C}_8\text{-Alkenyl}, \text{C}_3\text{-C}_8\text{-Alkinyl}, \text{C}_3\text{-C}_8\text{-Cycloalkyl}, \text{C}_1\text{-C}_8\text{-Halogenalkyl}, \text{C}_2\text{-C}_8\text{-Halogenalkenyl}, \text{C}_2\text{-C}_8\text{-Halogenalkinyl}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}, \text{C}_2\text{-C}_4\text{-Alkenyloxy-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}, \text{C}_2\text{-C}_4\text{-Alkinylloxy-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylthio-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylsulfinyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}, \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylsulfonyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}, \text{Cyano-C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl}, \text{Cyano-C}_2\text{-C}_8\text{-alkenyl}, \text{Cyano-C}_3\text{-C}_8\text{-alkinyl}, \text{gegebenenfalls substituiertes OH, SH, SO-H, -SO}_2\text{-H, COOH oder NH-COOH, -SO}_2\text{Cl, -N(R}^9, \text{R}^{10}), \text{-NH-SO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl), -N[-SO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl)]}_2, \text{-N(C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl) [-SO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl)]}, \text{-SO}_2\text{-N(R}^9, \text{R}^{10}), \text{-O-CO-NH-R}^9, \text{geg. subst. CHO, -O-CHO oder -NH-CHO, -NH-CO-NH-R}^9, \text{-O-CS-NH}_2, \text{-OCS-N(C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl)}_2, \text{-CO-N(R}^9, \text{R}^{10}), \text{-CS-N(R}^9, \text{R}^{10}), \text{-CO-NH-SO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl), -CO-N(C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl)-SO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl), Hydroxycarbonyl-C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl, (C}_1\text{-C}_8\text{-Alkoxy)carbonyl-C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl, -CH}_2\text{-CH(Halogen)-CO-N(R}^9, \text{R}^{10}), -CH}_2\text{-CH(Halogen)-CN, -CH}_2\text{-CH(Halogen)-CO-(C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl), geg. subst. -CH}_2\text{-CH(Halogen-COOH, -CH=C(Halogen)-COOH oder -CH=C(C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl)-COOH, geg. subst. -CH=N-OH oder -CH(-Y-R}^{15}, \text{-Z-R}^{15}), \text{(II) oder (III); R}^9, \text{R}^{10} = \text{H, C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl, C}_3\text{-C}_8\text{-Cycloalkyl, C}_2\text{-C}_8\text{-Alkenyl, C}_3\text{-C}_8\text{-Alkinyl, C}_1\text{-C}_8\text{-Halogenalkyl, C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl, C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylthio-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl, C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylsulfinyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl, C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylsulfonyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl, Cyano-C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl, Hydroxycarbonyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl, (C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy)carbonyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl, (C}_3\text{-C}_6\text{-Cycloalkoxy)carbonyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl, (C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy)carbonyl-C}_3\text{-C}_7\text{-cycloalkyl, C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy-(C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy)carbonyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl, C}_1\text{-C}_6\text{-Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Phenyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl, oder R}^9 + \text{R}^{10} \text{ zusammen = gegebenenfalls substituierte Tetramethylen-, Pentamethylen- oder Ethylenoxyethylenkette; Y, Z = O, S; R}^{15} = \text{C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl, C}_1\text{-C}_8\text{-Halogenalkyl, C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl; R}^{16}\text{-R}^{21} = \text{H, CN, C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl, C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl, C}_1\text{-C}_8\text{-Alkoxy, C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy-C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy, COOH, (C}_1\text{-C}_8\text{-Alkoxy)carbonyl, CONH}_2, \text{(C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl)aminocarbonyl, Di(C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl)aminocarbonyl; R}^6 = \text{H, NO}_2, \text{Halogen, gegebenenfalls substituiertes OH oder COOH; R}^7 = \text{H, NO}_2, \text{Halogen, gegebenenfalls substituiertes OH; ausgenommen diejenigen Verbindungen (I), bei denen X = CH}_2 \text{ und R}^5 = \text{geg. subst. OH sowie R}^3, \text{R}^7 = \text{H oder R}^1 = \text{Halogen sowie R}^3, \text{R}^4, \text{R}^6, \text{R}^7 = \text{H; Verwendung: als Herbizide; zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen.}$

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidshan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland			TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	ML	Mali	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MN	Mongolei	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MR	Mauretanien	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MW	Malawi	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	MX	Mexiko		
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CG	Kongo	KE	Kenia	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CM	Kamerun			PL	Polen		
CN	China	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CU	Kuba	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CZ	Tschechische Republik	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
DE	Deutschland	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DK	Dänemark	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
EE	Estland	LR	Liberia	SG	Singapur		

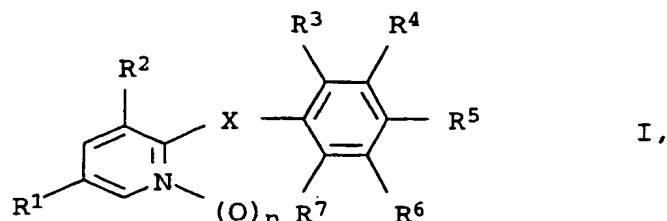
SUBSTITUIERTE 2-BENZ(O)YLPYRIDIN DERIVATE, DEREN HERSTELLUNG UND DEREN VERWENDUNG ALS HERBIZIDE

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft neue substituierte 2-Benz(o)ylpyridine der Formel I

10



15 in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

n 0 oder 1;

20 X Carbonyl, Methylen, CH(C₁-C₄-Alkyl), CH-OH, CH-CN, CH-Halogen, C(Halogen)₂, CH-CONH₂, CH-CO-O(C₁-C₄-Alkyl), CH-O(C₁-C₄-Alkyl) oder C(CN)(C₁-C₄-Alkyl);

R¹ Halogen, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl;

25

R² Wasserstoff oder Halogen;

R³ Wasserstoff, Nitro, Hydroxy, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy;

30

R⁴ Wasserstoff, Nitro, Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy;

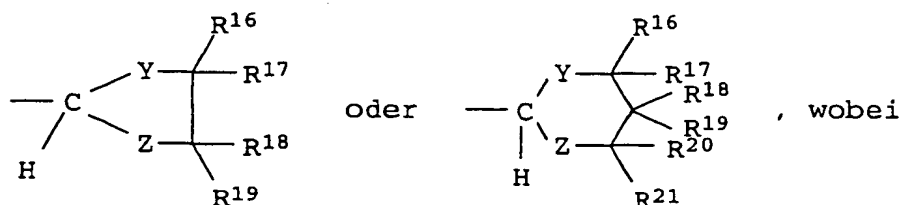
35

R⁵ Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₂-C₈-Halogenalkynyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-Alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-Alkynyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, Cyano-C₁-C₈-alkyl, Cyano-C₂-C₈-alkenyl, Cyano-C₃-C₈-alkynyl, -OR⁸, -SR⁸, -SO-R⁸, -SO₂-R⁸, -SO₂Cl, -N(R⁹, R¹⁰), -NH-SO₂-(C₁-C₈-Alkyl), -N[-SO₂-(C₁-C₈-Alkyl)]₂, -N(C₁-C₈-Alkyl)[-SO₂-(C₁-C₈-Alkyl)], -SO₂-N(R⁹, R¹⁰), -N(R¹¹)-CO-R¹², -NH-CO-OR⁸, -O-CO-NH-R⁹, -O-CO-R¹², -NH-CO-NH-R⁹, -O-CS-NH₂, -O-CS-N(C₁-C₈-Alkyl)₂, -CO-OR⁸, -CO-N(R⁹, R¹⁰), -CS-N(R⁹, R¹⁰), -CO-NH-SO₂-(C₁-C₄-Alkyl), -CO-N(C₁-C₄-Alkyl)-SO₂-(C₁-C₄-Alkyl), -CO-R¹², Hydroxy-carbonyl-C₁-C₈-alkyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl,

45

-CH₂-CH(Halogen)-CO-OR⁸, -CH₂-CH(Halogen)-CO-N(R⁹, R¹⁰),
 -CH₂-CH(Halogen)-CN, -CH₂-CH(Halogen)-CO-(C₁-C₄-Alkyl),
 -CH=C(Halogen)-CO-OR⁸, -CH=C(C₁-C₄-Alkyl)-CO-OR⁸, -CH=N-OR¹³,
 -C(R¹⁴)=N-OR¹³, -CH(-Y-R¹⁵, -Z-R¹⁵), -C(R¹⁴)(-Y-R¹⁵, -Z-R¹⁵),

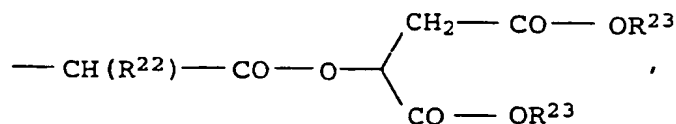
5



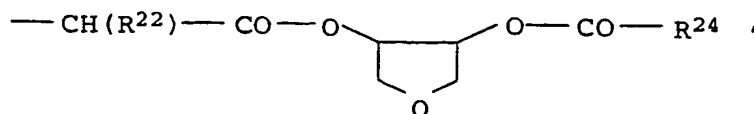
10

R⁸ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, Cyano-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, C₃-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₃-C₈-Alkenyloxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₃-C₈-Alkinylloxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₈-Halogenalkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₃-C₈-Cycloalkyloxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₃-C₆-Alkenyloxy)carbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₃-C₆-Alkinylloxy)carbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, Hydroxycarbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, Oxetan-3-yloxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, Benzyl oder Benzyloxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, wobei die Phenylringe der 3 letztgenannten Reste jeweils unsubstituiert sein oder ein bis drei Substituenten tragen können, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Nitro, Cyano, Hydroxy, Hydroxycarbonyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl und (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkoxy;

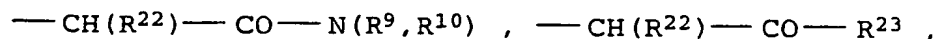
35



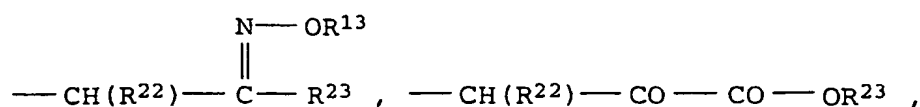
40



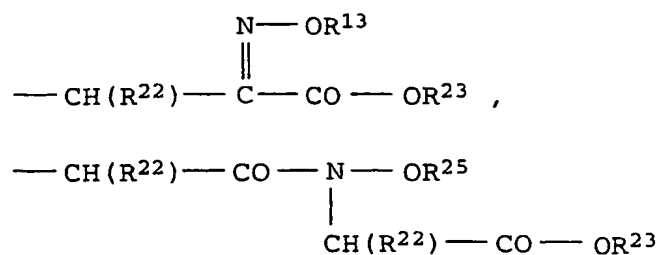
45



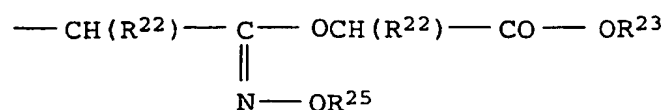
5



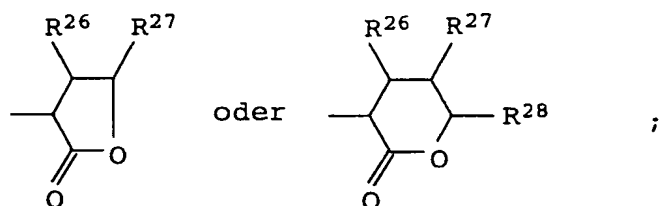
10



15



20



25

R^9, R^{10} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Alkenyl, C_3 - C_8 -Alkynyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl- C_1 - C_4 -alkyl, Cyano- C_1 - C_8 -alkyl, Hydroxycarbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, (C₃-C₇-Cycloalkyloxy)carbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl- C_3 -C₇-cycloalkyl, C_1 -C₄-Alkoxy-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 -C₆-Alkoxy, Phenyl oder Phenyl- C_1 - C_4 -alkyl, wobei die Phenylringe der letzten beiden Reste unsubstituiert sein oder ein bis drei Substituenten tragen können, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Nitro, Cyano, Hydroxy, Halogen, C_1 -C₄-Halogenalkyl, C_1 -C₄-Alkoxy, C_1 -C₄-Halogenalkoxy, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl und (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl- C_1 -C₄-alkoxy

30

35

40

oder R^9 und R^{10} zusammen für eine Tetramethylen-, Pentamethylen- oder Ethylenoxyethylenkette, die jeweils eine Hydroxycarbonylgruppe oder einen (C₁-C₆-Alkoxy)carbonylrest tragen kann;

45

R^{11} für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_3 - C_8 -Alkenyl oder C_3 - C_8 -Alkynyl;

R¹², R¹³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkynyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl, wobei die Phenylringe der letzten beiden Reste unsubstituiert sein oder ein bis drei Substituenten tragen können, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Nitro, Cyano, Hydroxy, Hydroxycarbonyl, Halogen, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl und (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkoxy;

R¹⁴ für C₁-C₈-Alkyl;

Y, Z unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel;

R¹⁵ für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl;

R¹⁶-R²¹ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, Hydroxycarbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₈-Alkyl)aminocarbonyl oder Di(C₁-C₈-alkyl)-aminocarbonyl;

R²²-R²⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Alkenyl oder C₃-C₈-Alkynyl

und

R²⁶-R²⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C₁-C₈-Alkyl stehen;

R⁶ Wasserstoff, Nitro, Halogen, -OR²⁹ oder -CO-OR²⁹ und

R⁷ Wasserstoff, Nitro, Halogen oder -OR³⁰,

wobei

R²⁹ und R³⁰ jeweils für eine der Bedeutungen von R⁸ stehen,

sowie die landwirtschaftlich brauchbaren Salze der Verbindungen I,

ausgenommen diejenigen Verbindungen I, bei denen X Methylen

bedeutet, und

- R⁵ für -OR⁸ sowie R³ und R⁷ beide für Wasserstoff stehen oder
- R¹ für Halogen sowie R³, R⁴, R⁶ und R⁷ alle gleichzeitig für Wasserstoff stehen.

45

Außerdem betrifft die Erfindung

- die Verwendung der Verbindungen I als Herbizide oder zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen,
- herbizide Mittel und Mittel zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen, welche die Verbindungen I als wirksame Substanzen enthalten,
- Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs und zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen mit den Verbindungen I sowie
- 10 - Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I und von herbiziden Mitteln und Mitteln zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen unter Verwendung der Verbindungen I.

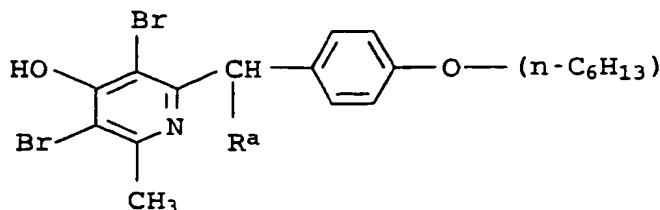
In der EP-A 047 972 wurden Phenoxyalkansäurederivate zur Erhöhung der Kohlehydrat-Einlagerung in Pflanzen beschrieben, deren allgemeine Formel - bei geeigneter Wahl der Variablen - auch Verbindungen I mit $n = 0$, $X = \text{Methylen}$, $R^1 = \text{Halogen}$, Di- oder Trifluormethyl, $R^2 = \text{Fluor oder Chlor}$, R^3, R^4, R^6 und $R^7 = \text{Wasserstoff}$ und $R^5 = \text{Ethoxy, 2-Butoxy oder But-3-en-2-yloxy}$, jeweils substituiert mit einem Hydroxycarbonyl-, bestimmten Ester-, Thioester- oder Säureamid-Rest, umfaßt.

Diejenigen 2-Benzylpyridine I mit $n = 0$, $X = \text{Methylen}$, $R^1 = \text{Halogen oder Trifluormethyl}$, R^3, R^4 und $R^7 = \text{Wasserstoff}$, $R^5 = \text{Ethoxy, 2-Butoxy oder But-3-en-2-yloxy}$, das jeweils eine bestimmte Säureamidgruppe trägt, und $R^6 = \text{Wasserstoff oder Halogen}$ fallen unter die allgemeine Formel von in der DE-A 29 48 095 als Herbizide und Fungizide gelehrtten Verbindungen.

30 Aus der schweizer Patentschrift CH 642 075 ist eine Verbindung mit $n = 0$, $X = \text{Methylen}$, $R^1 = \text{Chlor}$, $R^2 = \text{Wasserstoff}$, R^3, R^4, R^6 und $R^7 = \text{Wasserstoff}$ und $R^5 = 2\text{-(Ethoxycarbonyl)but-2-yloxy}$ bekannt, der eine pharmazeutische Wirkung zugeschrieben wird.

35 Benz(o)ylpyridine vom Typ der Verbindungen I fallen auch unter die allgemeinen Formeln von in der WO 92/22203, EP-A 078 536 und der EP-A 461 079 beschriebenen Herbiziden.

Aus T. Asami et al., Biosci. Biotech. Biochem. 57(2), 350/351 (1993) sind die beiden Benzylpyridine



mit $R^a = H$ (Nr. 20) oder OC_2H_5 (Nr. 21) als Photosynthesehemmer bekannt.

Schließlich werden in der WO 96/17829 bestimmte 3-Benzoylpyridine
5 als Herbizide gelehrt.

Da die herbiziden Eigenschaften der o.g. Herbizide bezüglich der Schadpflanzen nicht immer völlig befriedigen, lagen der vor-
liegenden Erfindung neue herbizid wirksame Verbindungen als Auf-
10 gabe zugrunde, mit denen sich unerwünschte Pflanzen besser als
bisher gezielt bekämpfen lassen. Die Aufgabe erstreckte sich auch
auf die Bereitstellung neuer desikkant/defoliant wirksamer
Verbindungen.

15 Demgemäß wurden die vorliegenden substituierten 2-Benz(o)yl-
pyridine der Formel I sowie deren herbizide Wirkung gefunden.

Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, die die Verbindungen I
enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Außerdem
20 wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfahren zur
Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit den Verbindungen I
gefunden.

Des weiteren wurde gefunden, daß die Verbindungen I auch zur
25 Desikkation/Defoliation von Pflanzenteilen geeignet sind, wofür
Kulturpflanzen wie Baumwolle, Kartoffel, Raps, Sonnenblume,
Sojabohne oder Ackerbohnen, insbesondere Baumwolle, in Betracht
kommen. Diesbezüglich wurden Mittel zur Desikkation und/oder
Defoliation von Pflanzen, Verfahren zur Herstellung dieser Mittel-
30 und Verfahren zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen
mit den Verbindungen I gefunden.

Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster
ein oder mehrere Chiralitätszentren enthalten und liegen dann
35 als Enantiomeren- oder Diastereomeregemische vor. Auch E-/Z-Iso-
mere sind möglich, sofern mindestens ein Substituent mit Doppel-
bindung vorhanden ist. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die
reinen Enantiomeren oder Diastereomeren als auch deren Gemische.

40 Unter landwirtschaftlich brauchbaren Salzen sind vor allem die
Salze von I mit denjenigen Kationen sowie Säureadditionssalze
von I mit solchen Säuren zu verstehen, welche die herbizide oder
desikkante/defoliant Wirkung von I nicht negativ beeinträch-
tigen.

So kommen als Kationen insbesondere die Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium, Magnesium und Barium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie das Ammonium-
5 ion, das einen C₁-C₄-Alkyl-, Phenyl- oder Benzylsubstituenten und gewünschtenfalls zusätzlich ein bis drei weitere C₁-C₄-Alkylreste tragen kann, vorzugsweise Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium, des
weiteren Phosphoniumionen, vorzugsweise Tri-(C₁-C₄-alkyl)-
10 phosphonium, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri-(C₁-C₄-alkyl)-sulfonium, sowie Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri-(C₁-C₄-alkyl)-sulfoxonium.

Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie
15 Fluorid, Chlorid, Bromid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Phosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat, Oxalat, Dodecylbenzolsulfonat, sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

20 Die für die Substituenten R¹, R³, R⁴, R⁵ und R⁸ bis R³⁰ oder als Reste an Phenylringen genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenstoffketten, also alle
25 Alkyl-, Halogenalkyl-, Cyanoalkyl-, Oxetanyloxycarbonylalkyl-, Hydroxycarbonylalkyl-, Phenylalkyl-, Phenoxycarbonylalkyl-, Benzyloxycarbonylalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkylthio-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkenyl-, Halogenalkenyl-, Cyanoalkenyl-, Alkenyloxy-, Alkinyl-, Halogenalkinyl-, Cyanoalkinyl-
30 und Alkinyloxy-Teile können geradkettig oder verzweigt sein. Halogenierte Substituenten tragen vorzugsweise ein bis fünf gleiche oder verschiedene Halogenatome.

Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor, Brom, Chlor oder
35 Iod, insbesondere für Fluor oder Chlor.

Ferner stehen beispielsweise:

- 40 - C₁-C₄-Alkyl für: CH₃, C₂H₅, CH₂-C₂H₅, CH(CH₃)₂, n-C₄H₉, CH(CH₃)-C₂H₅, CH₂-CH(CH₃)₂ oder C(CH₃)₃, insbesondere für CH₃ oder C₂H₅;
- 45 - C₁-C₄-Halogenalkyl für: einen C₁-C₄-Alkylrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. CH₂F, CHF₂, CF₃, CH₂Cl, CH(Cl)₂, C(Cl)₃, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl,

- 2-Iodethyl, $\text{CH}_2\text{-CHF}_2$, $\text{CH}_2\text{-CF}_3$, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, C_2F_5 , 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl, 2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl, $\text{CH}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, $\text{CF}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlor-methyl)-2-chlorethyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluor-butyl, 4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl oder Nonafluorbutyl, ins-
besondere für CH_2F , CHF_2 , CF_3 , CH_2Cl , 2-Fluorethyl, 2-Chlor-ethyl oder $\text{CH}_2\text{-CF}_3$;
- $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl}$ für: $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}$ wie vorstehend genannt, oder z.B. n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl oder 1-Ethyl-2-methylpropyl, insbesondere für CH_3 , C_2H_5 , $\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, n-Butyl, $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, n-Pentyl oder n-Hexyl;
- 25 - $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-Halogenalkyl}$ für: einen $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-Alkylrest}$ wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. einen der unter $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Halogenalkyl}$ genannten Reste oder für 5-Fluor-1-pentyl, 5-Chlor-1-pentyl, 5-Brom-1-pentyl, 5-Iod-1-pentyl, 5,5,5-Tri-chlor-1-pentyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluor-1-hexyl, 6-Chlor-1-hexyl, 6-Brom-1-hexyl, 6-Iod-1-hexyl, 6,6,6-Trichlor-1-hexyl oder Dodecafluorhexyl, insbesondere für CH_2F , CHF_2 , CF_3 , CH_2Cl , 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl oder $\text{CH}_2\text{-CF}_3$;
- 35 - Cyano- $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl}$ für: z.B. CH_2CN , 1-Cyanoeth-1-yl, 2-Cyanoeth-1-yl, 1-Cyanoprop-1-yl, 2-Cyanoprop-1-yl, 3-Cyanoprop-1-yl, 1-Cyanoprop-2-yl, 2-Cyanoprop-2-yl, 1-Cyanobut-1-yl, 2-Cyanobut-1-yl, 3-Cyanobut-1-yl, 4-Cyanobut-1-yl, 1-Cyano-but-2-yl, 2-Cyanobut-2-yl, 3-Cyanobut-2-yl, 4-Cyanobut-2-yl, 1-Cyano-2-methyl-prop-3-yl, 2-Cyano-2-methyl-prop-3-yl, 3-Cyano-2-methyl-prop-3-yl, 2-(CH_2CN)-prop-2-yl oder 2-Cyano-hex-6-yl, insbesondere für CH_2CN oder 2-Cyanoethyl;
- 45 - Oxetan-3-yloxy-carbonyl- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$ für: z.B. Oxetan-3-yloxy-carbonylmethyl, 2-(Oxetan-3-yloxy-carbonyl)ethyl, 2-(Oxetan-3-yloxy-carbonyl)prop-1-yl, 3-(Oxetan-3-yloxy-carbonyl)prop-1-yl, 2-(Oxetan-3-yloxy-carbonyl)but-1-yl, 3-(Oxetan-3-yloxy-

- carbonyl)but-1-yl, 4-(Oxetan-3-yloxy-carbonyl)but-1-yl, 1-(Oxetan-3-yloxy-carbonyl)but-2-yl, 3-(Oxetan-3-yloxy-carbonyl)but-2-yl, 4-(Oxetan-3-yloxy-carbonyl)but-2-yl, 1-(Oxetan-3-yloxy-carbonylmethyl)-eth-1-yl, 1-(Oxetan-3-yloxy-carbonylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl oder 1-(Oxetan-3-yloxy-carbonylmethyl)-prop-1-yl, insbesondere für Oxetan-3-yloxy-carbonylmethyl oder 2-(Oxetan-3-yloxy-carbonyl)ethyl;
- 5
- Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl für: CH₂COOH, CH(CH₃)COOH, 2-(COOH)ethyl, 1-(COOH)prop-1-yl, 2-(COOH)prop-1-yl, 10 3-(COOH)prop-1-yl, 1-(COOH)but-1-yl, 2-(COOH)but-1-yl, 3-(COOH)but-1-yl, 4-(COOH)but-1-yl, 1-(COOH)but-2-yl, 2-(COOH)but-2-yl, 3-(COOH)but-2-yl, 4-(COOH)but-2-yl, 1-(CH₂COOH)eth-1-yl, 1-(CH₂COOH)-1-(CH₃)-eth-1-yl oder 15 1-(CH₂COOH)-prop-1-yl, insbesondere für CH₂COOH oder 2-(COOH)ethyl;
- Hydroxycarbonyl-C₁-C₈-alkyl für: Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl wie vorstehend genannt, sowie z.B. 5-(COOH)pent-1-yl oder 20 6-(COOH)hex-1-yl;
- Phenyl-C₁-C₄-alkyl für: Benzyl, 1-Phenylethyl, 2-Phenylethyl, 1-Phenylprop-1-yl, 2-Phenylprop-1-yl, 3-Phenylprop-1-yl, 1-Phenylbut-1-yl, 2-Phenylbut-1-yl, 3-Phenylbut-1-yl, 25 4-Phenylbut-1-yl, 1-Phenylbut-2-yl, 2-Phenylbut-2-yl, 3-Phenylbut-2-yl, 4-Phenylbut-2-yl, 1-(Phenylmethyl)-eth-1-yl, 1-(Phenylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl oder 1-(Phenylmethyl)-prop-1-yl, insbesondere für Benzyl oder 2-Phenylethyl;
- 30
- Phenoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl für: Phenoxy-carbonyl-methyl, 1-(Phenoxy-carbonyl)ethyl, 2-(Phenoxy-carbonyl)ethyl, 1-(Phenoxy-carbonyl)prop-1-yl, 2-(Phenoxy-carbonyl)prop-1-yl, 3-(Phenoxy-carbonyl)prop-1-yl, 1-(Phenoxy-carbonyl)but-1-yl, 35 2-(Phenoxy-carbonyl)but-1-yl, 3-(Phenoxy-carbonyl)but-1-yl, 4-(Phenoxy-carbonyl)but-1-yl, 1-(Phenoxy-carbonyl)but-2-yl, 2-(Phenoxy-carbonyl)but-2-yl, 3-(Phenoxy-carbonyl)but-2-yl, 4-(Phenoxy-carbonyl)but-2-yl, 1-(Phenoxy-carbonyl-methyl)-eth-1-yl, 1-(Phenoxy-carbonyl-methyl)-1-(methyl)-eth-1-yl 40 oder 1-(Phenoxy-carbonyl-methyl)-prop-1-yl, insbesondere für Phenoxy-carbonyl-methyl oder 2-(Phenoxy-carbonyl)ethyl;
- Benzyloxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl für: Benzyloxy-carbonyl-methyl, 1-(Benzyloxy-carbonyl)ethyl, 2-(Benzyloxy-carbonyl)ethyl, 1-(Benzyloxy-carbonyl)prop-1-yl, 2-(Benzyloxy-carbonyl)- 45 prop-1-yl, 3-(Benzyloxy-carbonyl)prop-1-yl, 1-(Benzyloxy-carbonyl)but-1-yl, 2-(Benzyloxy-carbonyl)but-1-yl, 3-(Benzyloxy-

- oxycarbonyl)but-1-yl, 4-(Benzyloxycarbonyl)but-1-yl,
1-(Benzyloxycarbonyl)but-2-yl, 2-(Benzyloxycarbonyl)but-2-yl,
3-(Benzyloxycarbonyl)but-2-yl, 4-(Benzyloxycarbonyl)but-2-yl,
1-(Benzyloxycarbonyl-methyl)-eth-1-yl, 1-(Benzyloxycarbonyl-
5 methyl)-1-(methyl)-eth-1-yl oder 1-(Benzyloxycarbonyl-
methyl)-prop-1-yl, insbesondere für Benzyloxycarbonyl-methyl
oder 2-(Benzyloxycarbonyl)ethyl;
- 10 - C₁-C₄-Alkoxy für: OCH₃, OC₂H₅, n-Propoxy, OCH(CH₃)₂, n-Butoxy,
1-Methylpropoxy, OCH₂-CH(CH₃)₂ oder OC(CH₃)₃, insbesondere für
OCH₃ oder OC₂H₅;
- 15 - C₁-C₆-Alkoxy für: einen C₁-C₄-Alkoxy-Rest wie vorstehend
genannt, oder z.B. n-Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy,
3-Methylbutoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, n-Hex-
oxy, 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 1-Methyl-
pentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy,
1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy,
2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy,
20 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy,
1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy oder 1-Ethyl-
2-methylpropoxy, insbesondere für OCH₃, OC₂H₅, OCH₂-C₂H₅,
OCH(CH₃)₂, n-Butoxy, OC(CH₃)₃, n-Pentoxy oder n-Hexoxy;
- 25 - C₁-C₈-Alkoxy für: einen C₁-C₆-Alkoxy-Rest wie vorstehend ge-
nannt, oder z.B. O(n-C₇H₁₅) oder O(n-C₈H₁₇), insbesondere für
C₁-C₆-Alkoxy;
- 30 - C₁-C₄-Halogenalkoxy für: einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie vorstehend
genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,
Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. OCH₂F, OCHF₂,
OCF₃, OCH₂Cl, OCH(Cl)₂, OC(Cl)₃, Chlorfluormethoxy, Dichlor-
fluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlor-
ethoxy, 2-Bromethoxy, 2-Iodethoxy, OCH₂-CHF₂, OCH₂-CF₃,
35 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Di-
chlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, OC₂F₅, 2-Fluorprop-
oxy, 3-Fluorpropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy,
2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 2-Brom-
propoxy, 3-Brompropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Tri-
40 chlorpropoxy, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(Fluormethyl)-2-fluor-
ethoxy, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy, 1-(Brommethyl)-2-brom-
ethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy oder
n-C₄F₉, insbesondere für 2-Chlorethoxy oder OCH₂-CF₃;
- 45

- (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl für: CO-OCH₃, CO-OC₂H₅, CO-OCH₂-C₂H₅, CO-OCH(CH₃)₂, n-Butoxycarbonyl, CO-OCH(CH₃)-C₂H₅, CO-OCH₂-CH(CH₃)₂ oder CO-OC(CH₃)₃, insbesondere für CO-OCH₃ oder CO-OC₂H₅;
- 5 - (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl für: einen (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-Rest wie vorstehend genannt, oder z.B. (n-Pentoxy)carbonyl, 1-Methylbutoxycarbonyl, 2-Methylbutoxycarbonyl, 3-Methylbutoxycarbonyl, 2,2-Dimethylpropoxycarbonyl, 1-Ethylpropoxycarbonyl, (n-Hexoxy)carbonyl, 1,1-Dimethylpropoxycarbonyl, 1,2-Dimethylpropoxycarbonyl, 1-Methylpentoxycarbonyl, 2-Methylpentoxycarbonyl, 3-Methylpentoxycarbonyl, 4-Methylpentoxycarbonyl, 1,1-Dimethylbutoxycarbonyl, 1,2-Dimethylbutoxycarbonyl, 1,3-Dimethylbutoxycarbonyl, 2,2-Dimethylbutoxycarbonyl, 2,3-Dimethylbutoxycarbonyl, 3,3-Dimethylbutoxycarbonyl, 1-Ethylbutoxycarbonyl, 2-Ethylbutoxycarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropoxycarbonyl, 1,2,2-Trimethylpropoxycarbonyl, 1-Ethyl-1-methylpropoxycarbonyl oder 1-Ethyl-2-methylpropoxycarbonyl, insbesondere für COOCH₃, COOC₂H₅, n-Propoxycarbonyl, COOCH(CH₃)₂, n-Butoxycarbonyl, COOC(CH₃)₃, n-Pentoxycarbonyl oder n-Hexoxycarbonyl;
- 10 - (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl für: einen (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-Rest wie vorstehend genannt, oder z.B. CO-O(n-C₇H₁₅) oder CO-O(n-C₈H₁₇), insbesondere für (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- 15 - C₁-C₄-Alkylthio für: SCH₃, SC₂H₅, SCH₂-C₂H₅, SCH(CH₃)₂, n-Butylthio, SCH(CH₃)-C₂H₅, SCH₂-CH(CH₃)₂ oder SC(CH₃)₃, insbesondere für SCH₃ oder SC₂H₅;
- 20 - C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl für: durch C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend genannt substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für CH₂-OCH₃, CH₂-OC₂H₅, CH₂-OCH₂-C₂H₅, CH₂-OCH(CH₃)₂, n-Butoxymethyl, (1-Methylpropoxy)methyl, (2-Methylpropoxy)methyl, CH₂-OC(CH₃)₂, 2-(Methoxy)ethyl, 2-(Ethoxy)ethyl, 2-(n-Propoxy)ethyl, 2-(1-Methylethoxy)ethyl, 2-(n-Butoxy)ethyl, 2-(1-Methylpropoxy)ethyl, 2-(2-Methylpropoxy)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethyl, 2-(Methoxy)propyl, 2-(Ethoxy)propyl, 2-(n-Propoxy)propyl, 2-(1-Methylethoxy)propyl, 2-(n-Butoxy)propyl, 2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 3-(Methoxy)propyl, 3-(Ethoxy)propyl, 3-(n-Propoxy)propyl, 3-(1-Methylethoxy)propyl, 3-(n-Butoxy)propyl, 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 2-(Methoxy)butyl, 2-(Ethoxy)butyl, 2-(n-Propoxy)butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl, 2-(n-Butoxy)butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl, 2-(2-Methylpropoxy)butyl,
- 25 - (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl für: einen (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-Rest wie vorstehend genannt, oder z.B. CO-O(n-C₇H₁₅) oder CO-O(n-C₈H₁₇), insbesondere für (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- 30 - C₁-C₄-Alkylthio für: SCH₃, SC₂H₅, SCH₂-C₂H₅, SCH(CH₃)₂, n-Butylthio, SCH(CH₃)-C₂H₅, SCH₂-CH(CH₃)₂ oder SC(CH₃)₃, insbesondere für SCH₃ oder SC₂H₅;
- 35 - C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl für: durch C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend genannt substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für CH₂-OCH₃, CH₂-OC₂H₅, CH₂-OCH₂-C₂H₅, CH₂-OCH(CH₃)₂, n-Butoxymethyl, (1-Methylpropoxy)methyl, (2-Methylpropoxy)methyl, CH₂-OC(CH₃)₂, 2-(Methoxy)ethyl, 2-(Ethoxy)ethyl, 2-(n-Propoxy)ethyl, 2-(1-Methylethoxy)ethyl, 2-(n-Butoxy)ethyl, 2-(1-Methylpropoxy)ethyl, 2-(2-Methylpropoxy)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethyl, 2-(Methoxy)propyl, 2-(Ethoxy)propyl, 2-(n-Propoxy)propyl, 2-(1-Methylethoxy)propyl, 2-(n-Butoxy)propyl, 2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 3-(Methoxy)propyl, 3-(Ethoxy)propyl, 3-(n-Propoxy)propyl, 3-(1-Methylethoxy)propyl, 3-(n-Butoxy)propyl, 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 2-(Methoxy)butyl, 2-(Ethoxy)butyl, 2-(n-Propoxy)butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl, 2-(n-Butoxy)butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl, 2-(2-Methylpropoxy)butyl,
- 40 - (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl für: einen (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-Rest wie vorstehend genannt, oder z.B. CO-O(n-C₇H₁₅) oder CO-O(n-C₈H₁₇), insbesondere für (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- 45 - C₁-C₄-Alkylthio für: SCH₃, SC₂H₅, SCH₂-C₂H₅, SCH(CH₃)₂, n-Butylthio, SCH(CH₃)-C₂H₅, SCH₂-CH(CH₃)₂ oder SC(CH₃)₃, insbesondere für SCH₃ oder SC₂H₅;

- 2-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 3-(Methoxy)butyl, 3-(Ethoxy)-butyl, 3-(n-Propoxy)butyl, 3-(1-Methylethoxy)butyl, 3-(n-Butoxy)butyl, 3-(1-Methylpropoxy)butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 4-(Methoxy)butyl, 4-(Ethoxy)butyl, 4-(n-Propoxy)butyl, 4-(1-Methylethoxy)butyl, 4-(n-Butoxy)butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl, 4-(2-Methylpropoxy)butyl oder 4-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, insbesondere für $\text{CH}_2\text{-OCH}_3$ oder 2-Methoxyethyl;
- 10 - $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy-C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy}$ für: durch $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy}$ wie vorstehend genannt substituiertes $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy}$, also z.B. für $\text{OCH}_2\text{-OCH}_3$, $\text{OCH}_2\text{-OC}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{-OCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{-OCH}(\text{CH}_3)_2$, n-Butoxymethoxy, (1-Methylpropoxy)methoxy, (2-Methylpropoxy)methoxy, $\text{OCH}_2\text{-OC}(\text{CH}_3)_3$, 2-(Methoxy)ethoxy, 2-(Ethoxy)ethoxy, 2-(n-Propoxy)ethoxy, 2-(1-Methylethoxy)ethoxy, 2-(n-Butoxy)ethoxy, 2-(1-Methylpropoxy)ethoxy, 2-(2-Methylpropoxy)ethoxy, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethoxy, 2-(Methoxy)propoxy, 2-(Ethoxy)propoxy, 2-(n-Propoxy)propoxy, 2-(1-Methylethoxy)propoxy, 2-(n-Butoxy)propoxy, 2-(1-Methylpropoxy)propoxy, 2-(2-Methylpropoxy)propoxy, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propoxy, 3-(Methoxy)propoxy, 3-(Ethoxy)propoxy, 3-(n-Propoxy)propoxy, 3-(1-Methylethoxy)propoxy, 3-(n-Butoxy)propoxy, 3-(1-Methylpropoxy)propoxy, 3-(2-Methylpropoxy)propoxy, 3-(1,1-Dimethylethoxy)propoxy, 2-(Methoxy)butoxy, 2-(Ethoxy)butoxy, 2-(n-Propoxy)butoxy, 2-(1-Methylethoxy)butoxy, 2-(n-Butoxy)butoxy, 2-(1-Methylpropoxy)butoxy, 2-(2-Methylpropoxy)butoxy, 2-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 3-(Methoxy)butoxy, 3-(Ethoxy)butoxy, 3-(n-Propoxy)butoxy, 3-(1-Methylethoxy)butoxy, 3-(n-Butoxy)butoxy, 3-(1-Methylpropoxy)butoxy, 3-(2-Methylpropoxy)butoxy, 3-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 4-(Methoxy)butoxy, 4-(Ethoxy)butoxy, 4-(n-Propoxy)butoxy, 4-(1-Methylethoxy)butoxy, 4-(n-Butoxy)butoxy, 4-(1-Methylpropoxy)butoxy, 4-(2-Methylpropoxy)butoxy oder 4-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, insbesondere für $\text{OCH}_2\text{-OCH}_3$ oder 2-Methoxyethoxy;
- 40 - $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy})\text{carbonyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$ für: durch $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy})\text{-carbonyl}$ wie vorstehend genannt substituiertes $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}$, also z.B. für $\text{CH}_2\text{COOCH}_3$, $\text{CH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{COOCH}_3$ oder 2-(COOCH_3)ethyl;
- 45 - $(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-Alkoxy})\text{carbonyl-C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$ für: durch $(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-Alkoxy})\text{-carbonyl}$ wie vorstehend genannt substituiertes $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkyl}$, also z.B. für $\text{CH}_2\text{COOCH}_3$, $\text{CH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{COOCH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{COOC}_2\text{H}_5$, $\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{COOCH}_3$ oder $\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{COOC}_2\text{H}_5$;

- Hydroxycarbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl für:
(C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl wie vorstehend genannt, das
eine Hydroxycarbonylgruppe trägt, also z.B. für
CH₂-COOCH₂-COOH, CH(CH₃)-COOCH₂-COOH, CH₂-COOCH(CH₃)-COOH oder
5 CH(CH₃)-COOCH(CH₃)-COOH;

- C₁-C₄-Alkoxy-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl für:
(C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl wie vorstehend genannt, das
eine C₁-C₄-Alkoxygruppe wie OCH₃, OC₂H₅, OCH₂-C₂H₅, OCH(CH₃)₂,
10 n-Butoxy, OCH(CH₃)-C₂H₅, OCH₂-CH(CH₃)₂ und OC(CH₃)₃ trägt, also
z.B. für CH₂-COOCH₂-OCH₃, CH₂-COOCH₂-OC₂H₅,
CH₂-COOCH₂-OCH(CH₃)₂, CH₂-COOCH₂-OC(CH₃)₃, CH₂-COOCH₂-CH₂-OCH₃,
CH₂-COOCH₂-CH₂-OC₂H₅, CH(CH₃)-COOCH₂-CH₂-OCH₃ oder
CH(CH₃)-COOCH₂-CH₂-OC₂H₅, insbesondere für CH₂-COOCH₂-CH₂-OCH₃,
15 CH₂-COOCH₂-CH₂-OC₂H₅, CH(CH₃)-COOCH₂-CH₂-OCH₃ oder
CH(CH₃)-COOCH₂-CH₂-OC₂H₅;

- (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl für:
(C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl wie vorstehend genannt, das
eine (C₁-C₄-Alkoxy)carbonylgruppe wie COOCH₃, COOC₂H₅,
20 COOCH₂-C₂H₅, COOCH(CH₃)₂, COOCH₂-(n-C₃H₇), OCH(CH₃)-C₂H₅,
OCH₂-CH(CH₃)₂ und OC(CH₃)₃ trägt, also z.B. für
CH₂-COOCH₂-COOCH₃, CH₂-COOCH₂-COOC₂H₅, CH₂-COOCH₂-COOCH(CH₃)₂,
CH₂-COOCH₂-COOC(CH₃)₃, CH₂-COOCH₂-COOCH₃, CH₂-COOCH₂-COOC₂H₅,
25 CH(CH₃)-COOCH₂-COOCH₃, CH(CH₃)-COOCH₂-COOC₂H₅,
CH₂-COOCH(CH₃)-COOCH₃, CH₂-COOCH(CH₃)-COOC₂H₅,
CH(CH₃)-COOCH(CH₃)-COOCH₃ oder CH(CH₃)-COOCH(CH₃)-COOC₂H₅, ins-
besondere für CH₂-COOCH₂-COOCH₃, CH₂-COOCH₂-COOC₂H₅,
CH(CH₃)-COOCH₂-COOCH₃, CH(CH₃)-COOCH₂-COOC₂H₅,
30 CH₂-COOCH(CH₃)-COOCH₃, CH₂-COOCH(CH₃)-COOC₂H₅,
CH(CH₃)-COOCH(CH₃)-COOCH₃ oder CH(CH₃)-COOCH(CH₃)-COOC₂H₅;

- (C₁-C₈-Halogenalkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl für: durch
(C₁-C₈-Halogenalkoxy)carbonyl wie COOCH₂F, COOCHF₂, COOCF₃,
35 COOCH₂Cl, COOCH(Cl)₂, COOC(Cl)₃, COOCHFCl, COOCF(Cl)₂,
COOCF₂Cl, COOCF₂Br, COOCHF-CH₃, COOCH₂-CH₂F, COOCH₂-CH₂Cl,
COOCH₂-CH₂Br, COOCH₂-CH₂I, COOCH₂-CH₂F, COOCH₂-CF₃,
COOCH₂-CHFCl, COOCH₂-CF₂Cl, COOCH₂-CF(Cl)₂, COOCH₂-C(Cl)₃,
COOC₂F₅, 2-Fluorpropoxycarbonyl, 3-Fluorpropoxycarbonyl,
40 2-Chlorpropoxycarbonyl, 3-Chlorpropoxycarbonyl, 2-Bromprop-
oxycarbonyl, 3-Brompropoxycarbonyl, 2,2-Difluorpropoxycarbo-
nyl, 2,3-Difluorpropoxycarbonyl, 2,3-Dichlorpropoxycarbonyl,
COOCH₂CH₂-CF₃, COOCH₂CH₂-C(Cl)₃, COOCH₂-C₂F₅, COOCF₂-C₂F₅,
1-(CH₂F)-2-fluorethoxycarbonyl, 1-(OCH₂Cl)-2-chlorethoxycarbo-
45 nyl, 1-(OCH₂Br)-2-bromethoxycarbonyl, 4-Fluorbutoxycarbonyl,
4-Chlorbutoxycarbonyl, 4-Brombutoxycarbonyl, COOCF₂CF₂-C₂F₅,
5-Fluorpentoxycarbonyl, 5-Chlorpentoxycarbonyl, 5-Brompent-

- oxycarbonyl, 5-Iodpentoxycarbonyl, 5,5,5-Trichlorpentoxycarbonyl, $\text{COOCF}_2-(n-\text{C}_4\text{F}_9)$, 6-Fluorhexoxycarbonyl, 6-Chlorhexoxycarbonyl, 6-Bromhexoxycarbonyl, 6-Iodhexoxycarbonyl, 6,6,6-Trichlorhexoxycarbonyl und $\text{COOCF}_2-(n-\text{C}_5\text{F}_{11})$ substituiertes C_1 - C_6 -Alkyl, also z.B. für $\text{CH}_2\text{-COOCH}_2\text{-CF}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-COOCH}_2\text{-CF}_3$, $\text{CH}_2\text{-COOCH}_2\text{-C}(\text{Cl})_3$ oder $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-COOCH}_2\text{-C}(\text{Cl})_3$;
- (C_1 - C_4 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_4 -alkoxy für: durch
- 10 (C_1 - C_4 -Alkoxy)carbonyl wie vorstehend genannt substituiertes C_1 - C_4 -Alkoxy, also z.B. für $\text{OCH}_2\text{COOCH}_3$, $\text{OCH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{COOCH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{COOCH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{OCH}_2\text{COOC}(\text{CH}_3)_3$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{COOCH}_3$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{COOC}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{COOCH}_3$, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$,
- 15 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{COOCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{COOCH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, 2-[$\text{COOCH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$]ethoxy, 2-[$\text{COOCH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$]ethoxy, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{COOC}(\text{CH}_3)_3$, 2-(COOCH_3)propoxy, 2-(COOC_2H_5)propoxy, 2-($\text{COOCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$)propoxy, 2-[$\text{COOCH}(\text{CH}_3)_2$]propoxy, 2-($\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$)propoxy, 2-[$\text{COOCH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$]propoxy,
- 20 2-[$\text{COOCH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$]propoxy, 2-[$\text{COOC}(\text{CH}_3)_3$]propoxy, 3-(COOCH_3)propoxy, 3-(COOC_2H_5)propoxy, 3-($\text{COOCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$)propoxy, 3-[$\text{COOCH}(\text{CH}_3)_2$]propoxy, 3-($\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$)propoxy, 3-[$\text{COOCH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$]-propoxy, 3-[$\text{COOCH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$]propoxy, 3-[$\text{COOC}(\text{CH}_3)_3$]propoxy, 2-(COOCH_3)butoxy, 2-(COOC_2H_5)butoxy,
- 25 2-($\text{COOCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$)butoxy, 2-[$\text{COOCH}(\text{CH}_3)_2$]butoxy, 2-($\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$)butoxy, 2-[$\text{COOCH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$]butoxy, 2-[$\text{COOCH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$]butoxy, 2-[$\text{COOC}(\text{CH}_3)_3$]butoxy, 3-(COOCH_3)butoxy, 3-(COOC_2H_5)butoxy, 3-($\text{COOCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$)butoxy, 3-[$\text{COOCH}(\text{CH}_3)_2$]butoxy, 3-($\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$)butoxy,
- 30 3-[$\text{COOCH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$]butoxy, 3-[$\text{COOCH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$]butoxy, 3-[$\text{COOC}(\text{CH}_3)_3$]butoxy, 4-(COOCH_3)butoxy, 4-(COOC_2H_5)butoxy, 4-($\text{COOCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$)butoxy, 4-[$\text{COOCH}(\text{CH}_3)_2$]butoxy, 4-($\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$)butoxy, 4-[$\text{COOCH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$]butoxy, 4-[$\text{COOCH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$]butoxy oder 4-[1,1- $\text{COOC}(\text{CH}_3)_3$]butoxy, ins-
- 35 besondere für $\text{OCH}_2\text{-COOCH}_3$, $\text{OCH}_2\text{-COOC}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{-COOCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{-COOCH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{OCH}_2\text{-COOCH}_2\text{-CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{-COOCH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}_2\text{-COOCH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{OCH}_2\text{-COOCH}_2\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-COOCH}_3$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-COOC}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-COOCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-COOCH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-COOCH}_2\text{-CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-COOCH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$,
- 40 $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-COOCH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-COOC}(\text{CH}_3)_3$ oder $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-COOCH}_2\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$;
- C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl für: durch C_1 - C_4 -Alkylthio wie vorstehend genannt substituiertes C_1 - C_4 -Alkyl, also z.B.
- 45 für $\text{CH}_2\text{-SCH}_3$, $\text{CH}_2\text{-SC}_2\text{H}_5$, n-Propylthiomethyl, $\text{CH}_2\text{-SCH}(\text{CH}_3)_2$, n-Butylthiomethyl, (1-Methyl-propylthio)methyl, (2-Methyl-propylthio)methyl, $\text{CH}_2\text{-SC}(\text{CH}_3)_3$, 2-Methylthioethyl, 2-Ethyl-

- thioethyl, 2-(n-Propylthio)ethyl, 2-(1-Methylethylthio)ethyl,
2-(n-Butylthio)ethyl, 2-(1-Methyl-propylthio)ethyl,
2-(2-Methylpropylthio)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethylthio)ethyl,
2-(Methylthio)propyl, 3-(Methylthio)propyl, 2-(Ethyl-
5 thio)propyl, 3-(Ethylthio)propyl, 3-(Propylthio)propyl,
3-(Butylthio)propyl, 4-(Methylthio)butyl, 4-(Ethylthio)butyl,
4-(n-Propylthio)butyl oder 4-(n-Butylthio)butyl, insbesondere
für 2-(Methylthio)ethyl;
- 10 - C₁-C₄-Alkylsulfinyl für: SO-CH₃, SO-C₂H₅, SO-CH₂-C₂H₅,
SO-CH(CH₃)₂, n-Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl,
2-Methylpropylsulfinyl oder SO-C(CH₃)₃, insbesondere für
SO-CH₃ oder SO-C₂H₅;
- 15 - C₁-C₄-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl für: durch C₁-C₄-Alkylsulfinyl
wie vorstehend genannt, vorzugsweise SO-CH₃, substituiertes
C₁-C₄-Alkyl, also beispielsweise für CH₂-SO-CH₃ oder 2-Methyl-
sulfinylethyl;
- 20 - C₁-C₄-Alkylsulfonyl für: SO₂-CH₃, SO₂-C₂H₅, SO₂-CH₂-C₂H₅,
SO₂-CH(CH₃)₂, n-Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl,
SO₂-CH₂-CH(CH₃)₂ oder SO₂-C(CH₃)₃, insbesondere für SO₂-CH₃
oder SO₂-C₂H₅;
- 25 - C₁-C₄-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl für: durch C₁-C₄-Alkylsulfonyl
wie vorstehend genannt, vorzugsweise SO₂-CH₃, substituiertes
C₁-C₄-Alkyl, also beispielsweise für CH₂-SO₂-CH₃ oder
2-Methylsulfonylethyl;
- 30 - (C₁-C₈-Alkyl)aminocarbonyl für: z.B. CO-NH-CH₃, CO-NH-C₂H₅,
CO-NH-CH₂-C₂H₅, CO-NH-CH(CH₃)₂, CO-NH-CH₂CH₂-C₂H₅,
CO-NH-CH(CH₃)C₂H₅, CO-NH-CH₂-CH(CH₃)₂, CO-NH-C(CH₃)₃, n-Pentyl-
aminocarbonyl, 1-Methylbutylaminocarbonyl, 2-Methylbutyl-
aminocarbonyl, 3-Methylbutylaminocarbonyl, 2,2-Dimethyl-
35 propylaminocarbonyl, 1-Ethylpropylaminocarbonyl, n-Hexyl-
aminocarbonyl, 1,1-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1,2-Dimethyl-
propylaminocarbonyl, 1-Methylpentylaminocarbonyl, 2-Methyl-
pentylaminocarbonyl, 3-Methylpentylaminocarbonyl, 4-Methyl-
40 pentylaminocarbonyl, 1,1-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1,2-Di-
methylbutylaminocarbonyl, 1,3-Dimethylbutylaminocarbonyl,
2,2-Dimethylbutylaminocarbonyl, 2,3-Dimethylbutylamino-
carbonyl, 3,3-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1-Ethylbutylamino-
carbonyl, 2-Ethylbutylaminocarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropyl-
aminocarbonyl, 1,2,2-Trimethylpropylaminocarbonyl, 1-Ethyl-1-
45 methylpropylaminocarbonyl oder 1-Ethyl-2-methylpropylamino-
carbonyl, insbesondere für CO-NH-CH₃, CO-NH-C₂H₅, n-Propyl-
aminocarbonyl, CO-NH-CH(CH₃)₂, n-Butylaminocarbonyl,

CO-NH-C(CH₃)₃, n-Pentylaminocarbonyl oder n-Hexylamino-carbonyl;

- Di(C₁-C₈-alkyl)aminocarbonyl für: z.B. CO-N(CH₃)₂, CO-N(C₂H₅)₂,
 5 CO-N(CH₂-C₂H₅)₂, CO-N[CH(CH₃)₂]₂, CO-N(n-C₄H₉)₂,
 CO-N[CH(CH₃)-C₂H₅]₂, CO-N[CH₂-CH(CH₃)₂]₂, CO-N[C(CH₃)₃]₂,
 CO-N(CH₃)-C₂H₅, CO-N(CH₃)-CH₂-C₂H₅, CO-N(CH₃)-CH(CH₃)₂,
 CO-N(CH₃)-(n-C₄H₉), CO-N(CH₃)-CH(CH₃)-C₂H₅,
 CO-N(CH₃)-CH₂-CH(CH₃)₂, CO-N(CH₃)-C(CH₃)₃, CO-N(C₂H₅)-CH₂-C₂H₅,
 10 CO-N(C₂H₅)-CH(CH₃)₂, CO-N(C₂H₅)-(n-C₄H₉),
 CO-N(C₂H₅)-CH(CH₃)-C₂H₅, CO-N(C₂H₅)-CH₂-CH(CH₃)₂,
 CO-N(C₂H₅)-C(CH₃)₃, N-[CH(CH₃)₂]-N-propylaminocarbonyl, N-Butyl-N-propylaminocarbonyl, N-[1-Methylpropyl]-N-propylamino-carbonyl, N-[2-Methylpropyl]-N-propylaminocarbonyl,
 15 N-[C(CH₃)₃]-N-propylaminocarbonyl, N-Butyl-N-[1-methyl-ethyl]aminocarbonyl, N-[CH(CH₃)₂]-N-(1-methylpropyl)amino-carbonyl, N-[CH(CH₃)₂]-N-[2-methylpropyl]aminocarbonyl,
 N-[C(CH₃)₃]-N-[CH(CH₃)₂]aminocarbonyl, N-Butyl-N-[(1-methyl-propyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-[2-methylpropyl]amino-carbonyl,
 20 N-Butyl-N-[C(CH₃)₃]aminocarbonyl, N-[1-Methyl-propyl]-N-[2-methylpropyl]aminocarbonyl,
 N-[C(CH₃)₃]-N-[1-methylpropyl]aminocarbonyl oder
 N-[C(CH₃)₃]-N-[2-methylpropyl]aminocarbonyl, insbesondere für
 CO-N(CH₃)₂ oder CO-N(C₂H₅)₂;
 25
- C₃-C₈-Alkenyl für: z.B. Prop-2-en-1-yl, n-Buten-4-yl,
 1-Methyl-prop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, 2-Buten-1-yl, n-Penten-3-yl, n-Penten-4-yl, 1-Methyl-but-2-en-1-yl,
 2-Methyl-but-2-en-1-yl, 3-Methyl-but-2-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl, 2-Methyl-but-3-en-1-yl, 3-Methyl-but-3-en-1-yl,
 30 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yl, n-Hex-3-en-1-yl, n-Hex-4-en-1-yl, n-Hex-5-en-1-yl, 1-Methyl-pent-3-en-1-yl, 2-Methyl-pent-3-en-1-yl, 3-Methyl-pent-3-en-1-yl, 4-Methyl-pent-3-en-1-yl, 1-Methyl-pent-4-en-1-yl, 2-Methyl-pent-4-en-1-yl, 3-Methyl-pent-4-en-1-yl, 4-Methyl-pent-4-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-3-en-1-yl, 2-Ethyl-but-2-en-1-yl, 2-Ethyl-but-3-en-1-yl, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl,
 45 n-Hept-2-en-1-yl, n-Hept-3-en-1-yl, n-Oct-2-en-1-yl

oder n-Oct-3-en-1-yl, insbesondere für Prop-2-en-1-yl oder n-Buten-4-yl;

- 5 - C₃-C₈-Halogenalkenyl für: C₃-C₆-Alkenyl wie vorstehend genannt, das partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. 2-Chlorallyl, 3-Chlorallyl, 2,3-Dichlorallyl, 3,3-Dichlorallyl, 2,3,3-Trichlorallyl, 2,3-Dichlorbut-2-enyl, 2-Bromallyl, 3-Bromallyl, 2,3-Dibromallyl, 3,3-Dibromallyl, 2,3,3-Tribromallyl oder
10 2,3-Dibrombut-2-enyl, insbesondere für 2-Chlorallyl oder 3,3-Dichlorallyl;
- 15 - C₂-C₈-Halogenalkenyl für: 1-Chlorvinyl, 2-Chlorvinyl, 1,2-Dichlorvinyl, 1,2,2-Trichlorvinyl oder einen der vorstehend genannten C₃-C₈-Halogenalkenyl-Reste;
- 20 - Cyano-C₂-C₈-alkenyl für: z.B. 2-Cyanovinyl, 3-Cyanoallyl, 4-Cyano-but-2-enyl, 4-Cyano-but-3-enyl oder 5-Cyanopent-4-enyl, vorzugsweise 3-Cyanoallyl oder 4-Cyanobut-2-enyl, insbesondere für 3-Cyanoallyl;
- 25 - C₂-C₄-Alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl für: durch C₂-C₄-Alkenyloxy wie Vinyloxy, Prop-2-enyloxy, But-1-en-3-yloxy, But-1-en-4-yloxy, n-But-2-enyloxy, n-But-3-enyloxy, 1-Methyl-prop-2-enyloxy oder 2-Methyl-prop-2-enyloxy - vorzugsweise Allyloxy, 2-Methylprop-2-en-1-yloxy, But-1-en-3-yloxy, But-1-en-4-yloxy oder But-2-en-1-yloxy - substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also
30 beispielsweise für Vinyloxymethyl, Allyloxymethyl, 2-(Allyloxy)ethyl oder But-1-en-4-yloxymethyl;
- 35 - (C₃-C₆-Alkenyloxy)carbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl für: (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl wie vorstehend genannt, das eine (C₃-C₆-Alkenyloxy)carbonylgruppe wie Prop-1-en-1-yl-O-CO, Prop-2-en-1-yl-O-CO, 1-Methylethenyl-O-CO, n-Buten-1-yl-O-CO, n-Buten-2-yl-O-CO, n-Buten-3-yl-O-CO, 1-Methyl-prop-1-en-1-yl-O-CO, 2-Methyl-prop-1-en-1-yl-O-CO, 1-Methyl-prop-2-en-1-yl-O-CO, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl-O-CO, n-Penten-1-yl-O-CO, n-Penten-2-yl-O-CO, n-Penten-3-yl-O-CO, n-Penten-4-yl-O-CO, 1-Methyl-but-1-en-1-yl-O-CO,
40 2-Methyl-but-1-en-1-yl-O-CO, 3-Methyl-but-1-en-1-yl-O-CO, 1-Methyl-but-2-en-1-yl-O-CO, 2-Methyl-but-2-en-1-yl-O-CO, 3-Methyl-but-2-en-1-yl-O-CO, 1-Methyl-but-3-en-1-yl-O-CO, 2-Methyl-but-3-en-1-yl-O-CO, 3-Methyl-but-3-en-1-yl-O-CO, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yl-O-CO, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yl-O-CO, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl-O-CO,
45 1-Ethyl-prop-1-en-2-yl-O-CO, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yl-O-CO, n-Hex-1-en-1-yl-O-CO, n-Hex-2-en-1-yl-O-CO, n-Hex-3-en-1-yl-

- 5 O-CO, n-Hex-4-en-1-yl-O-CO, n-Hex-5-en-1-yl-O-CO, 1-Methyl-pent-1-en-1-yl-O-CO, 2-Methyl-pent-1-en-1-yl-O-CO, 3-Methyl-pent-1-en-1-yl-O-CO, 4-Methyl-pent-1-en-1-yl-O-CO, 1-Methyl-pent-2-en-1-yl-O-CO, 2-Methyl-pent-2-en-1-yl-O-CO, 3-Methyl-pent-2-en-1-yl-O-CO, 4-Methyl-pent-2-en-1-yl-O-CO, 1-Methyl-pent-3-en-1-yl-O-CO, 2-Methyl-pent-3-en-1-yl-O-CO, 3-Methyl-pent-3-en-1-yl-O-CO, 4-Methyl-pent-3-en-1-yl-O-CO, 1-Methyl-pent-4-en-1-yl-O-CO, 2-Methyl-pent-4-en-1-yl-O-CO, 3-Methyl-pent-4-en-1-yl-O-CO, 4-Methyl-pent-4-en-1-yl-O-CO, 1,1-Di-
- 10 methyl-but-2-en-1-yl-O-CO, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yl-O-CO, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yl-O-CO, 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yl-O-CO, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl-O-CO, 1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl-O-CO, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl-O-CO, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl-O-CO, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl-O-CO, 2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl-O-CO, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl-O-CO, 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl-O-CO, 3,3-Dimethyl-
- 15 but-1-en-1-yl-O-CO, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl-O-CO, 1-Ethyl-but-1-en-1-yl-O-CO, 1-Ethyl-but-2-en-1-yl-O-CO, 1-Ethyl-but-3-en-1-yl-O-CO, 2-Ethyl-but-1-en-1-yl-O-CO, 2-Ethyl-but-2-en-1-yl-O-CO, 2-Ethyl-but-3-en-1-yl-O-CO, 1,1,2-Tri-
- 20 methyl-prop-2-en-1-yl-O-CO, 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yl-O-CO, 1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yl-O-CO und 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl-O-CO trägt, also z.B. für $\text{CH}_2\text{-COOCH}_2\text{-COOCH}_2\text{-CH=CH}_2$, $\text{CH}_2\text{-COOCH(CH}_3\text{)-COOCH}_2\text{-CH=CH}_2$,
- 25 $\text{CH(CH}_3\text{)-COOCH(CH}_3\text{)-COOCH}_2\text{-CH=CH}_2$ oder $\text{CH(CH}_3\text{)-COOCH(CH}_3\text{)-COOCH}_2\text{-CH=CH}_2$;
- 30 (C₃-C₈-Alkenyloxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl für: C₁-C₆-Alkyl, das einen (C₃-C₆-Alkenyloxy)carbonyl-Rest - wie vorstehend genannt - oder z.B. n-Hept-2-en-1-yl-O-CO, n-Hept-3-en-1-yl-O-CO, n-Oct-2-en-1-yl-O-CO oder n-Oct-3-en-1-yl-O-CO trägt, also beispielsweise für Allyloxycarbonylmethyl, 2-(Allyloxy-carbonyl)ethyl oder But-1-en-4-yloxy-carbonyl-methyl;
- 35 - C₃-C₈-Alkynyl für: z.B. Propargyl, n-But-1-in-3-yl, n-But-1-in-4-yl, n-But-2-in-1-yl, n-Pent-1-in-3-yl, n-Pent-1-in-4-yl, n-Pent-1-in-5-yl, n-Pent-2-in-1-yl, n-Pent-2-in-4-yl, n-Pent-2-in-5-yl, 3-Methyl-but-1-in-3-yl, 3-Methyl-but-1-in-4-yl, n-Hex-1-in-3-yl, n-Hex-1-in-4-yl, n-Hex-1-in-5-yl, n-Hex-1-
- 40 in-6-yl, n-Hex-2-in-1-yl, n-Hex-2-in-4-yl, n-Hex-2-in-5-yl, n-Hex-2-in-6-yl, n-Hex-3-in-1-yl, n-Hex-3-in-2-yl, 3-Methyl-pent-1-in-3-yl, 3-Methyl-pent-1-in-4-yl, 3-Methyl-pent-1-in-5-yl, 4-Methyl-pent-2-in-4-yl oder 4-Methyl-pent-2-in-5-yl, insbesondere für Propargyl;
- 45

- C₂-C₈-Halogenalkinyl für: Ethinyl oder C₃-C₆-Alkinyl wie vorstehend genannt, das partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. für 1,1-Difluorprop-2-in-1-yl, 4-Fluorbut-2-in-1-yl, 4-Chlorbut-2-in-1-yl, 1,1-Difluorbut-2-in-1-yl, 5-Fluorpent-3-in-1-yl oder 6-Fluorhex-4-in-1-yl;
5

- Cyano-C₃-C₈-alkinyl für: z.B. 1-Cyanopropargyl, 3-Cyanopropargyl, 4-Cyanobut-2-in-1-yl, 5-Cyanopent-3-in-1-yl oder 6-Cyanohex-4-in-1-yl;
10

- C₂-C₄-Alkinyloxy-C₁-C₄-alkyl für: durch C₂-C₄-Alkinyloxy wie Ethinyloxy, Propargyloxy, n-But-1-in-3-yloxy, n-But-1-in-4-yloxy und n-But-2-in-1-yloxy, substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also beispielsweise für CH₂-OC≡CH, CH₂-OCH₂-C≡CH oder 2-(Propargyloxy)ethyl;
15

- (C₃-C₆-Alkinyloxy)carbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl für: (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl wie vorstehend genannt, das eine (C₃-C₆-Alkinyloxy)carbonylgruppe wie Propargyl-O-CO, Prop-2-in-1-yl-O-CO, n-But-1-in-1-yl-O-CO, n-But-1-in-3-yl-O-CO, n-But-1-in-4-yl-O-CO, n-But-2-in-1-yl-O-CO, n-Pent-1-in-1-yl-O-CO, n-Pent-1-in-3-yl-O-CO, n-Pent-1-in-4-yl-O-CO, n-Pent-1-in-5-yl-O-CO, n-Pent-2-in-1-yl-O-CO, n-Pent-2-in-4-yl-O-CO, n-Pent-2-in-5-yl-O-CO, 3-Methylbut-1-in-3-yl-O-CO, 3-Methylbut-1-in-4-yl-O-CO, n-Hex-1-in-1-yl-O-CO, n-Hex-1-in-3-yl-O-CO, n-Hex-1-in-4-yl-O-CO, n-Hex-1-in-5-yl-O-CO, n-Hex-1-in-6-yl-O-CO, n-Hex-2-in-1-yl-O-CO, n-Hex-2-in-4-yl-O-CO, n-Hex-2-in-5-yl-O-CO, n-Hex-2-in-6-yl-O-CO, n-Hex-3-in-1-yl-O-CO, n-Hex-3-in-2-yl-O-CO, 3-Methylpent-1-in-1-yl-O-CO, 3-Methylpent-1-in-3-yl-O-CO, 3-Methylpent-1-in-4-yl-O-CO, 3-Methylpent-1-in-5-yl-O-CO, 4-Methylpent-1-in-1-yl-O-CO, 4-Methylpent-2-in-4-yl-O-CO und 4-Methylpent-2-in-5-yl-O-CO trägt, also z.B. für CH₂-COOCH₂-COOCH₂-C≡CH, CH₂-COOCH(CH₃)-COOCH₂-C≡CH, CH(CH₃)-COOCH₂-COOCH₂-C≡CH oder CH(CH₃)-COOCH(CH₃)-COOCH₂-C≡CH;
20
25
30
35

- (C₃-C₈-Alkinyloxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl für: C₁-C₆-Alkyl, das vorzugsweise einen (C₃-C₆-Alkinyloxy)carbonyl-Rest wie vorstehend genannt, insbesondere CO-OCH₂-C≡CH, But-1-in-3-yl-O-CO, But-1-in-4-yl-O-CO oder But-2-in-1-yl-O-CO, trägt, also beispielsweise für CH₂-CO-OCH₂-C≡CH oder 2-(Propargyloxy)carbonyl)ethyl;
40
45

- C₃-C₈-Cycloalkyl für: Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl oder Cyclooctyl, insbesondere für Cyclopentyl oder Cyclohexyl;
- 5 - (C₃-C₇-Cycloalkyloxy) carbonyl-C₁-C₄-alkyl für: z.B. Cyclopropyloxycarbonylmethyl, Cyclobutyloxycarbonylmethyl, Cyclopentyloxycarbonylmethyl, Cyclohexyloxycarbonylmethyl, Cycloheptyloxycarbonylmethyl, 1-(Cyclopropyloxycarbonyl)ethyl, 1-(Cyclobutyloxycarbonyl)ethyl, 1-(Cyclopentyloxy-
- 10 carbonyl)ethyl, 1-(Cyclohexyloxycarbonyl)ethyl, 1-(Cycloheptyloxycarbonyl)ethyl, 2-(Cyclopropyloxycarbonyl)ethyl, 2-(Cyclobutyloxycarbonyl)ethyl, 2-(Cyclopentyloxy-carbonyl)ethyl, 2-(Cyclohexyloxycarbonyl)ethyl, 2-(Cycloheptyloxycarbonyl)ethyl, 3-(Cyclopropyloxycarbonyl)propyl, 3-(Cyclobutyloxycarbonyl)propyl, 3-(Cyclopentyloxy-
- 15 carbonyl)propyl, 3-(Cyclohexyloxycarbonyl)propyl, 3-(Cycloheptyloxycarbonyl)propyl, 4-(Cyclopropyloxycarbonyl)butyl, 4-(Cyclobutyloxycarbonyl)butyl, 4-(Cyclopentyloxy-carbonyl)butyl, 4-(Cyclohexyloxycarbonyl)butyl oder
- 20 4-(Cycloheptyloxycarbonyl)butyl, insbesondere für Cyclopentyloxycarbonyl-methyl, Cyclohexyloxycarbonyl-methyl oder 2-(Cyclopentyloxycarbonyl)ethyl;
- (C₃-C₈-Cycloalkyloxy) carbonyl-C₁-C₆-alkyl für: z.B. Cyclopropyloxycarbonylmethyl, Cyclobutyloxycarbonylmethyl, Cyclopentyloxycarbonylmethyl, Cyclohexyloxycarbonylmethyl, Cycloheptyloxycarbonylmethyl, Cyclooctyloxycarbonylmethyl, 1-(Cyclopropyloxycarbonyl)ethyl, 1-(Cyclobutyloxycarbonyl)ethyl, 1-(Cyclopentyloxycarbonyl)ethyl, 1-(Cyclohexyloxycarbonyl)-
- 25 ethyl, 1-(Cycloheptyloxycarbonyl)ethyl, 1-(Cyclooctyloxy-carbonyl)ethyl, 2-(Cyclopropyloxycarbonyl)ethyl, 2-(Cyclobutyloxycarbonyl)ethyl, 2-(Cyclopentyloxycarbonyl)ethyl, 2-(Cyclohexyloxycarbonyl)ethyl, 2-(Cycloheptyloxycarbonyl)-ethyl, 2-(Cyclooctyloxycarbonyl)ethyl, 3-(Cyclopropyloxy-
- 30 carbonyl)propyl, 3-(Cyclobutyloxycarbonyl)propyl, 3-(Cyclopentyloxycarbonyl)propyl, 3-(Cyclohexyloxycarbonyl)propyl, 3-(Cycloheptyloxycarbonyl)propyl, 3-(Cyclooctyloxycarbonyl)-propyl, 4-(Cyclopropyloxycarbonyl)butyl, 4-(Cyclobutyloxy-
- 35 carbonyl)butyl, 4-(Cyclopentyloxycarbonyl)butyl, 4-(Cyclohexyloxycarbonyl)butyl, 4-(Cycloheptyloxycarbonyl)butyl, 4-(Cyclooctyloxycarbonyl)butyl, 5-(Cyclopropyloxycarbonyl)-pentyl, 5-(Cyclobutyloxycarbonyl)pentyl, 5-(Cyclopentyloxy-
- 40 carbonyl)pentyl, 5-(Cyclohexyloxycarbonyl)pentyl, 5-(Cycloheptyloxycarbonyl)pentyl, 5-(Cyclooctyloxycarbonyl)pentyl, 6-(Cyclopropyloxycarbonyl)hexyl, 6-(Cyclobutyloxycarbonyl)-hexyl, 6-(Cyclopentyloxycarbonyl)hexyl, 6-(Cyclohexyloxy-
- 45 carbonyl)hexyl, 6-(Cycloheptyloxycarbonyl)hexyl oder

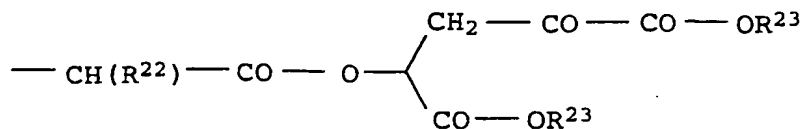
6-(Cyclooctyloxycarbonyl)hexyl, insbesondere für Cyclopentyloxycarbonyl-methyl, Cyclohexyloxycarbonyl-methyl oder 2-(Cyclopentyloxycarbonyl)ethyl;

- 5 - C₅-C₈-Cycloalkenyl für: Cyclopent-1-enyl, Cyclopent-2-enyl, Cyclopent-3-enyl, Cyclohex-1-enyl, Cyclohex-2-enyl, Cyclohex-3-enyl, Cyclohept-1-enyl, Cyclohept-2-enyl, Cyclohept-3-enyl, Cyclohept-4-enyl, Cyclooct-1-enyl, Cyclooct-2-enyl, Cyclooct-3-enyl oder Cyclooct-4-enyl, insbesondere für Cyclopent-1-enyl, Cyclopent-2-enyl, Cyclohex-1-enyl oder Cyclohex-2-enyl;
- 10 - (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₃-C₇-cycloalkyl für: z.B. Methoxycarbonylcyclopentyl, Ethoxycarbonylcyclopentyl, Methoxycarbonylcyclohexyl oder Ethoxycarbonylcyclohexyl.
- 15

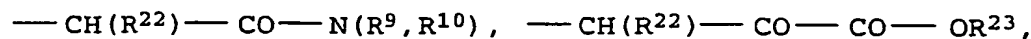
Im Hinblick auf die Verwendung der substituierten 2-Benz(o)ylpyridine I als Herbizide und/oder als desikkant/defoliant wirk-
same Verbindungen haben die Variablen vorzugsweise folgende Be-
20 deutungen, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination:

- n Null;
- X Carbonyl oder Methylen, insbesondere Methylen;
- 25 R¹ C₁-C₄-Halogenalkyl, insbesondere Trifluormethyl;
- R² Halogen, insbesondere Chlor;
- 30 R³ Halogen, insbesondere Chlor;
- R⁴ Halogen, insbesondere Chlor;
- 35 R⁵ -OR⁸, -CO-OR⁸, -CO-N(R⁹,R¹⁰) oder -CH=N-OR¹³, insbesondere -OR⁸;
- R⁶ Wasserstoff oder Halogen, insbesondere Wasserstoff;
- R⁷ Wasserstoff oder Halogen, insbesondere Wasserstoff;
- 40 R⁸ Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₃-C₈-Alkenyloxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₃-C₈-Alkinyl-oxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-
- 45 C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl,

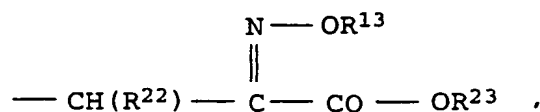
22



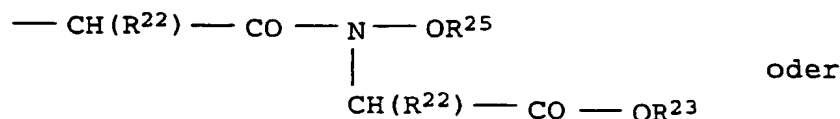
5



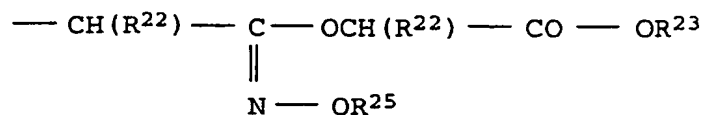
10



15



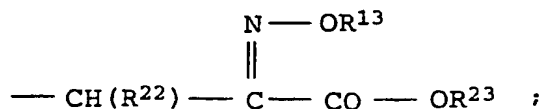
20



25

insbesondere Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl,
C₃-C₈-Alkynyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl,
-CH(R²²)-CO-N(R⁹, R¹⁰), -CH(R²²)-CO-CO-OR²³ oder

30



R⁹, R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl oder (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, insbesondere C₁-C₈-Alkyl;

35

R¹³ Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkynyl oder (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, insbesondere C₁-C₈-Alkyl;

R²² Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl oder C₃-C₈-Alkynyl, insbesondere C₁-C₈-Alkyl;

40

R²³ Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl oder C₃-C₈-Alkynyl, insbesondere C₁-C₈-Alkyl;

R²⁵ Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl oder C₃-C₈-Alkynyl, insbesondere C₁-C₈-Alkyl.

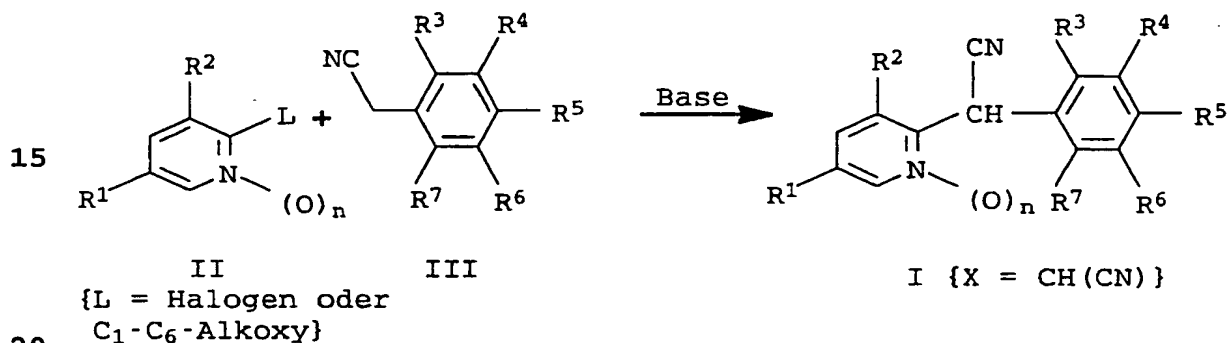
45

Die substituierten 2-Benz(o)ylpyridine der Formel I sind auf verschiedene Weise erhältlich, beispielsweise nach einem der folgenden Verfahren:

5 Verfahren A)

Umsetzung von substituierten Pyridinen der Formel II mit Benzyl-
nitrilen der Formel III in Gegenwart einer Base {vgl. z.B.
R.J. Wolters et al., J. Pharmaceut. Sciences 64, 2013 (1975);
Z.-T. Huang et al., Synth. Commun. 23, 591 (1993);

10 H. Yamanaka und S. Ohba, Heterocycles 31, 895 (1990):



Üblicherweise arbeitet man in einem inerten Lösungs- oder
Verdünnungsmittel, insbesondere einem dipolar aprotischen
Lösungsmittel, z.B. in N,N-Dimethylformamid, N-Methyl-
pyrrolidon oder in einem Ether wie Diethylether, 1,2-Di-
ethoxyethan, Tetrahydrofuran und Dioxan.

25

Als Basen kommen z.B. die Alkalimetallhydride, -amide,
-carbonate und -hydrogencarbonate, ferner Stickstoffbasen
wie Triethylamin, Pyridin und 4-Dimethylaminopyridin, in
Betracht. Außerdem können auch die Alkalimetallsalze von
sperrigen Alkoholen wie Kalium-tert.-butylat verwendet
werden.

30

Die Reaktionstemperatur liegt normalerweise bei 0 bis 150°C.

35

Üblicherweise werden die Reaktionspartner in etwa stöchio-
metrischen Mengen eingesetzt, jedoch kann ein Überschuß einer
der Komponenten, z.B. im Hinblick auf einen möglichst voll-
ständigen Umsatz der anderen Komponente, vorteilhaft sein.

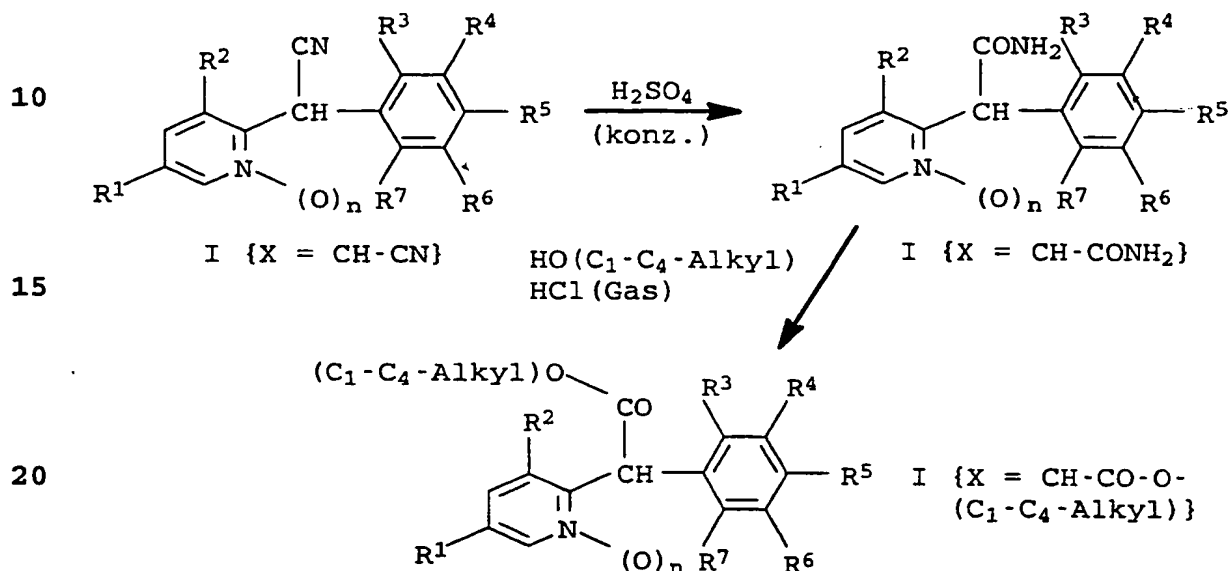
40

Die substituierten Pyridine II und Benzylnitrile III sind
entweder bekannt und z.T. sogar kommerziell erhältlich, oder
sind nach an sich bekannten Methoden leicht herstellbar. Zur
Herstellung von Benzylnitrile aus Benzylhalogeniden sei z.B.
auf V.G. Telang und C.J. Smith, J. Pharm. Sci. 59, 1521
(1970) verwiesen.

45

Verfahren B)

Partielle Hydrolyse von Verbindungen I mit $X = \text{CH}(\text{CN})$, z.B. in konz. Schwefelsäure {vgl. z.B. R.J. Wolters et al., J. Pharm. Sci. 64, 2013 (1975)}, zu subst. 2-Benz(o)ylpyridinen I mit $X = \text{CH}-\text{CONH}_2$, deren Alkoholyse {vgl. auch hierzu z.B. R.J. Wolters et al.} zu 2-Benz(o)ylpyridinen I mit $X = \text{CH}-\text{CO}-\text{O}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-Alkyl})$ führt:



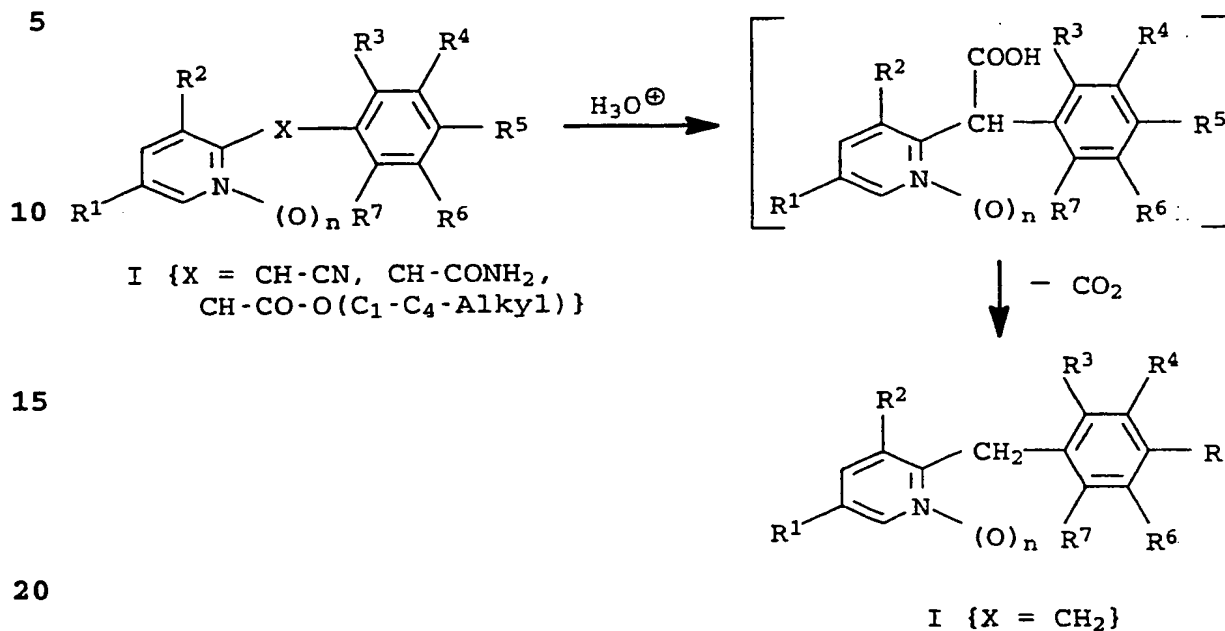
Die Hydrolyse mit konz. Schwefelsäure wird üblicherweise bei 0 bis 50°C, vorzugsweise bei Raumtemperatur, vorgenommen.

Die anschließende Alkoholyse erfolgt bevorzugt in überschüssigem Alkohol $\text{HO}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-Alkyl})$ als Lösungsmittel, jedoch können auch andere inerte Lösungs-/Verdünnungsmittel verwendet werden. Die Alkoholyse wird durch Mineralsäuren wie Chlorwasserstoff katalysiert.

Normalerweise arbeitet man bei 0 bis 150°C, vorzugsweise bei der Siedetemperatur des Alkohols $\text{HO}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-Alkyl})$.

Verfahren C)

Hydrolyse von 2-Benz(o)ylpyridinen der Formel I, bei denen X für CH-CN, CH-CONH₂ oder CH-CO-O(C₁-C₄-Alkyl) steht, in Gegenwart einer wäßrigen Säure:



Als Säuren können z.B. Mineralsäuren wie Salzsäure, Bromwasserstoffsäure und Schwefelsäure oder organische Säuren wie Trifluoressigsäure verwendet werden.

Als Lösungsmittel dient vorzugsweise Wasser, dem zum Zwecke der besseren Lösung der Edukte gewünschtenfalls ein inertes Cosolvens, z.B. Essigsäure oder Dimethylsulfoxid, zugesetzt wird.

Üblicherweise arbeitet man bei Temperaturen von 0 bis 150°C, vorzugsweise bei der Siedetemperatur des Lösungsmittels.

Die als Zwischenprodukte entstehenden Carbonsäuren können in der Regel nicht isoliert werden und decarboxylieren unter den angegebenen Reaktionsbedingungen meist spontan.

Verfahren D,

Oxidation von 2-Benz(o)ylpyridinen der Formel I {X = CH-CN} mit (Luft)sauerstoff in Gegenwart einer Base {vgl. z.B.

M.S. Kharasch und G. Sosnovsky, Tetrahedron 3, 97 (1958);

5 H.G. Aurich, Tetrahedron Lett. 12, 657 (1964);

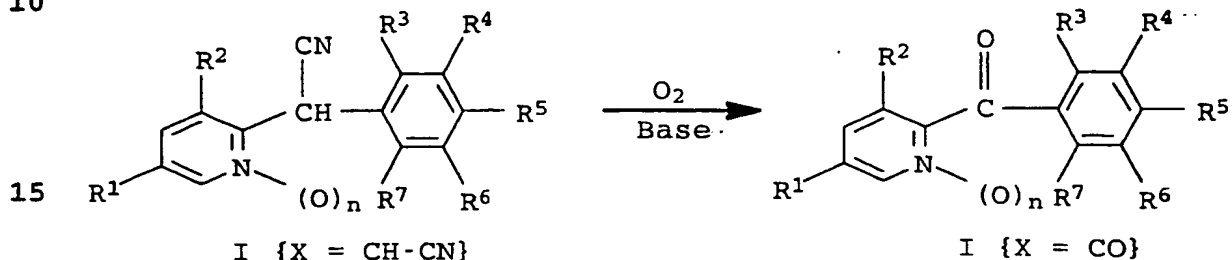
S.S. Kulp, Org. Prep. and Proced. 2, 137 (1970);

A. Donetti et al., Synthesis 1980, 1009;

J.F. Wolfe et al., J. Het. Chem. 24, 1061 (1987);

H. Yamanaka und S. Ohba, Heterocycles 31, 895 (1990)}:

10



Als Base kommen z.B. die Alkalimetallhydride, -amide, -carbonate und -hydrogencarbonate, ferner Stickstoffbasen wie Triethylamin, Pyridin und 4-Dimethylaminopyridin, in Betracht. Außerdem können auch die Alkalimetallsalze von sperrigen Alkoholen wie Kalium-tert.-butylat verwendet werden.

25 Als Lösungsmittel eignen sich sowohl protische, z.B. Alkohole wie Methanol und Ethanol, als auch dipolar aprotische Solventien, z.B. Dimethylsulfoxid oder Ether wie Tetrahydrofuran und Dioxan.

30 Die Reaktion wird üblicherweise bei Temperaturen zwischen 0 und 50°C durchgeführt, vorzugsweise bei Raumtemperatur. Der Reaktionsverlauf kann gewünschtenfalls mit einem Phasentransferkatalysator wie Triethylbenzylammoniumchlorid beschleunigt werden.

35

Verfahren E,

Reduktion von 2-Benz(o)ylpyridinen I {X = CO} mit komplexen

Hydriden wie NaBH₄ und LiAlH₄ oder mittels katalytischer Hydrierung in Gegenwart eines Übergangsmetallkatalysators, z.B. Raney-

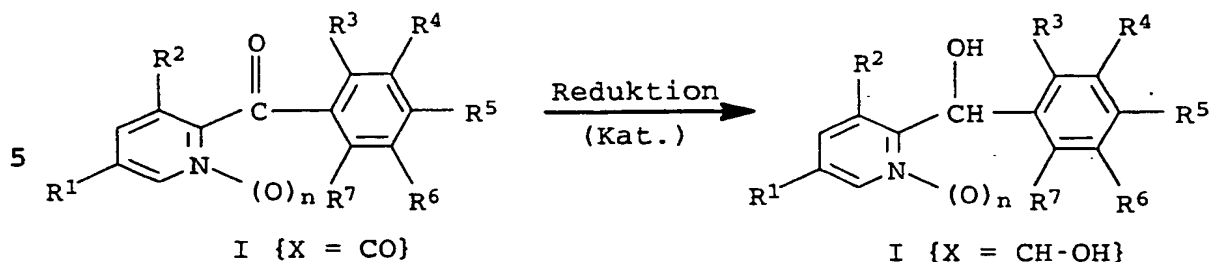
40 Nickel oder Platin/Kohle, auf an sich bekannte Weise {vgl. z.B. C. Vaccher et al., J. Het. Chem. 26, 811-815 (1989);

G.R. Newkome et al., J. Org. Chem. 49, 2961-2971 (1984);

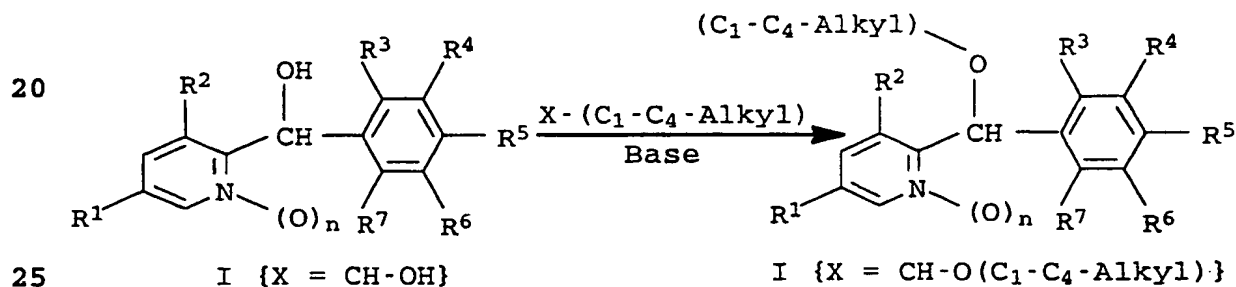
A. Garcia et al., Tetrahedron Lett. 34, 1797-1798 (1993);

M. Takeshita et al., Heterocycles 35, 879-884 (1993);

45 M. Takemoto et al., Chem. Pharm. Bull. 42, 802-805 (1994)}:



Die Verfahrensprodukte I mit X = CH-OH können anschließend in
 10 Gegenwart einer Base mit Alkylhalogeniden X-(C₁-C₄-Alkyl), wobei
 X für Chlor, Brom oder Iod steht, alkyliert werden {vgl. z.B.
 D.E. Beattie et al., J. Med. Chem. 20, 714-718 (1977);
 J. Crosby et al., Tetrahedron Lett. 30, 3849-3852 (1989);
 S. Jriuchijima et al., J. Am. Chem. Soc. 96, 4280 (1974);
 15 S. Sakuraba et al., Tetrahedron: Asymmetry 4, 1457-1460 (1993);
 Ya.G. Bal'on et al., Ukr. Khim. Zh. (Russ. Ed.) 57, 191-195
 (1991)}:



Als Basen kommen z.B. die Alkalimetallhydroxide wie Natrium-
 hydroxid, die Alkalimetallhydride wie Natriumhydrid, die
 Alkalimetallamide wie Natriumamid oder die Alkalimetallsalze
 30 von Alkoholen wie Kalium-tert.-butylat in Betracht.

In der Regel arbeitet man in einem inerten Lösungs-/Ver-
 dünnungsmittel, wobei sowohl dipolar aprotische Solventien,
 z.B. N,N-Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder Ether wie
 35 Diethylether, Tetrahydrofuran und 1,4-Dioxan, als auch
 protische Solventien, z.B. Alkohole wie tert.-Butanol, in
 Betracht kommen.

Die Reaktionsführung erfolgt normalerweise bei einer Reak-
 40 tionstemperatur von 0 bis 150°C, vorzugsweise bei 20 bis
 100°C.

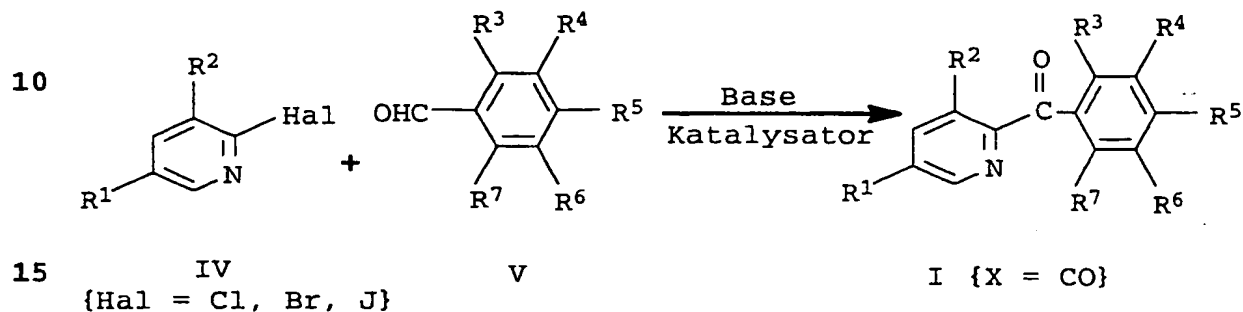
Verfahren E)

Nukleophile Benzoylierung von Halogenpyridinen der Formel IV mit Benzaldehyden V in Gegenwart einer Base und eines Katalysators (vgl. z.B. H. Stetter, Angew. Chem. 88, 695 (1976);

5 A. Miyashita et al., Chem. Pharm. Bull. 38, 1147-1152 (1990);

A. Miyashita et al., *ibid* 40, 43-48 und 2627-2631 (1992);

A. Miyashita et al., *ibid* 42, 2017-2022 (1994)}:



Als Basen können beispielsweise die Alkalimetallhydride wie Natriumhydrid oder die Alkalimetallamide wie Natriumamid verwendet werden.

Als Lösungsmittel eignen sich z.B. dipolar aprotische Solventien, z.B. N,N-Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder cyclische Ether wie Tetrahydrofuran und 1,4-Dioxan.

Als Katalysator dienen insbesondere (substituierte) (Benz)-imidazoliumsalze und (substituierte) (Benz)thiazoliumsalze, z.B. 1,3-Dimethylimidazoliumchlorid, 1,3-Dimethylimidazoliumbromid, 1,3-Dimethylimidazoliumiodid, 1,3-Benzimidazoliumchlorid, 1,3-Benzimidazoliumbromid und 1,3-Dimethylbenzimidazoliumiodid.

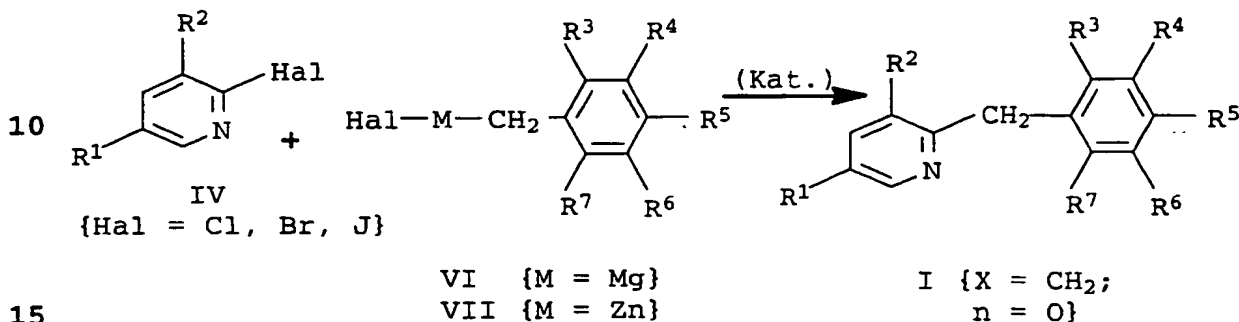
Die Menge des Katalysators kann bis zu 50 %, vorzugsweise 5 bis 20 %, bezogen auf die molare Menge des eingesetzten Halogenpydridins, betragen.

Die Reaktion wird üblicherweise bei Temperaturen von 0 bis 150°C durchgeführt, vorzugsweise bei Temperaturen von 20 bis 100°C.

Verfahren G,

Umsetzung von Halogenpyridinen IV mit Benzylmagnesiumhalogeniden VI oder Benzylzinkhalogeniden VII, gegebenenfalls in Gegenwart eines Übergangsmetallkatalysators {vgl. z.B.

- 5 E. Negishi et al., J. Org. Chem. 42, 1821 (1977) und
M. Kumada et al., Tetrahedron Lett. 21, 845 (1980)}:



Die Verbindungen VI und VII können leicht aus den entsprechenden Benzylhalogeniden und Magnesium oder Zink hergestellt werden, beispielsweise nach M. Gaudemar, Bull. Soc. Chim. Fr., 1962, S. 974.

20

Als Katalysatoren eignen sich insbesondere Nickel-Katalysatoren, z.B. Ni[P(Phenyl)₃]₄ oder Ni[P(Phenyl)₃]₂Cl₂, und Palladium-Katalysatoren, z.B. Pd[P(Phenyl)₃]₄, Pd[P(Phenyl)₃]₂Cl₂, Pd[1,2-Bis-(diphenylphosphino)-ethan]Cl₂,
25 Pd[1,4-Bis-(diphenylphosphino)-butan]Cl₂ oder
Pd[1,1'-Bis-(diphenylphosphino)-ferrocen]Cl₂.

30

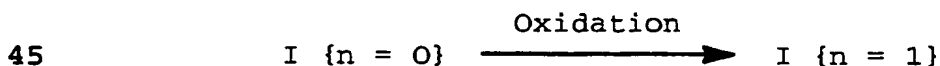
Die Reaktionsführung erfolgt in der Regel in einem inerten organischen Lösungsmittel, z.B. in einem Ether wie Diethylether und Tetrahydrofuran.

Normalerweise arbeitet man bei 0 bis 150°C, vorzugsweise bei 20 bis 100°C.

35 Verfahren H,

Oxidation von substituierten 2-Benz(o)ylpyridinen der Formel I, bei denen n Null bedeutet, auf an sich bekannte Weise {vgl. z.B. A. Albini und S. Pietra, Heterocyclic N-Oxides, CRC-Press Inc., Boca Raton, USA 1991;

- 40 H.S. Mosher et al., Org. Synth. Coll. Vol. IV, 1963, S. 828;
E.C. Taylor et al., Org. Synth. Coll. Vol. IV, 1963, S. 704;
T.W. Bell et al., Org. Synth. 69, 226 (1990)}:



Unter den zur Oxidation des Pyridinrings üblichen Oxidationsmitteln sei beispielhaft auf Peressigsäure, Pertrifluoressigsäure, Perbenzoesäure, m-Chlorperbenzoesäure, Monopermaleinsäure, Magnesiummonoperphthalat, Natriumperborat, Oxone®
5 (enthält Peroxidisulfat), Perwolframsäure und Wasserstoffperoxid verwiesen.

Geeignete Lösungsmittel sind z.B. Wasser, Schwefelsäure, Carbonsäuren wie Essigsäure und Trifluoressigsäure sowie
10 halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und Chloroform.

Normalerweise gelingt die Oxidation bei Temperaturen von 0°C bis Siedetemperatur des Reaktionsgemisches.
15

Das Oxidationsmittel wird normalerweise in mindestens äquimolaren Mengen, bezogen auf die Ausgangsverbindung, eingesetzt. In Einzelfällen kann auch ein großer Überschuß
20 an Oxidationsmittel Vorteile bieten.

20 Sofern nicht anders angegeben, werden alle vorstehend beschriebenen Verfahren zweckmäßigerweise bei Atmosphärendruck oder unter dem Eigendruck des jeweiligen Reaktionsgemisches vorgenommen.

25 Die Aufarbeitung der Reaktionsgemische erfolgt in der Regel auf an sich bekannte Weise. Sofern nicht bei den vorstehend beschriebenen Verfahren etwas anderes angegeben ist, erhält man die Wertprodukte z.B. nach Verdünnen der Reaktionslösung mit Wasser durch Filtration, Kristallisation oder Lösungsmittlextraktion, oder
30 durch Entfernen des Lösungsmittels, Verteilen des Rückstandes in einem Gemisch aus Wasser und einem geeigneten organischen Lösungsmittel und Aufarbeiten der organischen Phase auf das Produkt hin.

35 Die substituierten 2-Benz(o)ylpyridine I können bei der Herstellung als Isomerengemische anfallen, die jedoch gewünschtenfalls nach den hierfür üblichen Methoden wie Kristallisation oder Chromatographie, auch an einem optisch aktiven Adsorbat, in die weitgehend reinen Isomeren getrennt werden können. Reine optisch
40 aktive Isomere lassen sich vorteilhaft aus entsprechenden optisch aktiven Ausgangsprodukten herstellen.

Landwirtschaftlich brauchbare Salze der Verbindungen I können durch Reaktion mit einer Base des entsprechenden Kations, vorzugs-
45 weise einem Alkalimetallhydroxid oder -hydrid, oder durch Reaktion mit einer Säure des entsprechenden Anions, vorzugsweise der

Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure oder Salpetersäure, gebildet werden.

- Salze von I, deren Metallion kein Alkalimetallion ist, können
- 5 auch durch Umsalzen des entsprechenden Alkalimetallsalzes in üblicher Weise hergestellt werden, ebenso Ammonium-, Phosphonium-, Sulfonium- und Sulfoxoniumsalze mittels Ammoniak, Phosphonium-, Sulfonium- oder Sulfoxoniumhydroxiden.
- 10 Die Verbindungen I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis,
- 15 Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schädgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

- Unter Berücksichtigung der Vielseitigkeit der Applikations-
- 20 methoden können die Verbindungen I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:
- Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus
- 25 officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica),
- 30 Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum
- 35 usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre,
- 40 Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera und Zea mays.

- 45 Darüber hinaus können die Verbindungen I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwendet werden.

Des weiteren eignen sich die substituierten 2-Benz(o)ylpyridine I auch zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen.

Als Desikkantien eignen sie sich insbesondere zur Austrocknung
5 der oberirdischen Teile von Kulturpflanzen wie Kartoffel, Raps, Sonnenblume und Sojabohne. Damit wird ein vollständig mechanisches Beernten dieser wichtigen Kulturpflanzen ermöglicht.

Von wirtschaftlichem Interesse ist ferner die Ernteerleichterung,
10 die durch das zeitlich konzentrierte Abfallen oder Vermindern der Haftfestigkeit am Baum bei Zitrusfrüchten, Oliven oder bei anderen Arten und Sorten von Kern-, Stein- und Schalenobst ermöglicht wird. Derselbe Mechanismus, das heißt die Förderung der Ausbildung von Trenngewebe zwischen Frucht- oder Blatt- und
15 Sproßteil der Pflanzen ist auch für ein gut kontrollierbares Entblättern von Nutzpflanzen, insbesondere Baumwolle, wesentlich.

Außerdem führt die Verkürzung des Zeitintervalls, in dem die einzelnen Baumwollpflanzen reif werden, zu einer erhöhten Faser-
20 qualität nach der Ernte.

Die Verbindungen I bzw. die sie enthaltenden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen
25 oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die
30 feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Als inerte Hilfsstoffe kommen im wesentlichen in Betracht: Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen
35 oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffine, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole und deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol
40 und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergier-
45 baren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die substituierten 2-Benz(o)ylpyridine I als solche oder in einem Öl

33

oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende 5 Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

- Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, 10 Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensa- tionsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate 15 mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxy- ethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkyl- arylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylen- 20 oxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.
- 25 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.
- Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate 30 können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit und Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Dünge- 35 mittel wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat und Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrin- den-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.
- 40 Die Konzentrationen der Wirkstoffe I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Im allgemeinen enthalten die Formulierungen etwa 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines Wirkstoffs I. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 45 90 % bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die folgenden Formulierungsbeispiele verdeutlichen die Herstellung solcher Zubereitungen:

- I. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 2 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 108 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- III. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 118 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 460 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- V. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 369 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

- VI. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 470 werden mit
2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure,
8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Gewichts-
5 teilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-
Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen
Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige
Dispersion.
- VII. 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. 490 wird in einer
10 Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon,
20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und
10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht.
Anschließend kann die Mischung mit Wasser auf die
gewünschte Wirkstoffkonzentration verdünnt werden.
15 Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- VIII. 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. 491 wird in einer
Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexan und
20 Gewichtsteilen Wettol® EM 31 (= nichtionischer Emulgator
20 auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl; BASF AG) be-
steht. Danach kann mit Wasser auf die gewünschte Wirkstoff-
konzentration verdünnt werden. Man erhält ein stabiles
Emulsionskonzentrat.
- 25 Die Applikation der Wirkstoffe I bzw. der herbiziden Mittel kann
im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Sind die
Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so
können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die
herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden,
30 daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit
nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter
darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte
Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).
- 35 Die Aufwandmengen an Wirkstoff I betragen je nach Bekämpfungs-
ziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis
3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).
- Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung
40 synergistischer Effekte können die substituierten 2-Benz(o)yl-
pyridine I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder
wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam
ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner
1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure
45 und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryl-
oxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoesäure und deren
Derivate, Benzothiadiazinone, 2-(Heteroaryl/Aroyl)-1,3-cyclohexan-

dione, Heteroaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CF₃-Phenyl-derivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexan-1,3-dion-derivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, 5 Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenyl-ether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenyl-10 essigsäure und deren Derivate, 2-Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbon-säure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonyl-harnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarbox-amide und Uracile in Betracht.

15

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, bei- spielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder 20 phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

25 Herstellungsbeispiele

Beispiel 1: 3-Chlor-2-[1-(4-chlorphenyl)-1-cyanomethyl]-5-tri- fluormethylpyridin (Verfahren A)

30 1,65 g einer 80%igen Suspension von Natriumhydrid in Mineralöl wurden zur Entfernung des Mineralöls mit 30 ml wasserfreiem N,N-Dimethylformamid gewaschen. Zu dem erhaltenen Natriumhydrid gab man 25 ml N,N-Dimethylformamid, wonach innerhalb von 20 Minuten eine Lösung von 7,6 g 4-Chlorbenzylcyanid in 25 ml 35 N,N-Dimethylformamid zugetropft wurde. Dabei entstand unter Gasentwicklung eine rote Suspension, die noch 15 Minuten gerührt wurde. Anschließend tropfte man innerhalb von 20 Minuten unter exothermer Reaktion 10,8 g 2,3-Dichlor-5-trifluormethylpyridin in das Reaktionsgemisch. Nach beendeter Zugabe wurde noch 20 Minuten 40 nachgerührt und die Reaktionsmischung dann in 2 l Wasser einge- rührt. Aus der wässrigen Phase extrahierte man das Produkt mit dreimal 200 ml tert.-Butyl-methylether. Die vereinigten organi- schen Phasen wurden schließlich über Magnesiumsulfat getrocknet und dann eingeeengt. Die Reinigung des Rohproduktes erfolgte 45 mittels Chromatographie an Kieselgel (Laufmittel: Cyclohexan/ Essigsäureethylester = 4:1). Ausbeute: 6,9 g (42 %) eines farb- losen Öls;

¹H-NMR (270 MHz; in CDCl₃): δ [ppm] = 5,78 (s,1H), 7,36 (d,2H), 7,45 (d,2H), 7,98 (s,1H), 8,84 (s,1H).

Beispiel 2: 3-Chlor-2-[1-(2,3-dichlorphenyl)-1-cyanomethyl]-5-trifluormethylpyridin (Verfahren A)

Analog zu Beispiel 1 erhielt man aus 1,65 g Natriumhydrid-suspension, 9,3 g 2,3-Dichlorbenzylcyanid und 10,8 g 2,3-Dichlor-5-trifluormethylpyridin 10,0 g eines farblosen Öls.

10 Ausbeute: 55 %;

¹H-NMR (400 MHz; in CDCl₃): δ [ppm] = 6,20 (s,1H), 7,30 (t,1H), 7,50-7,56 (m,2H), 8,03 (s,1H), 8,78 (s,1H).

Beispiel 3: 2-[1-Carbamoyl-1-(4-chlorphenyl)-methyl]-3-chlor-5-trifluormethylpyridin (Verfahren B)

6,0 g 3-Chlor-2-[1-(4-chlorphenyl)-1-cyanomethyl]-5-trifluormethylpyridin (hergestellt nach Beispiel 1) wurden in 30 ml 96%iger Schwefelsäure 16 Stunden bei 23°C gerührt. Danach rührte man die Reaktionsmischung vorsichtig in 200 ml Eiswasser ein, wobei das Produkt auskristallisierte. Der Feststoff wurde abgetrennt, nacheinander mit Wasser und n-Hexan gewaschen und dann getrocknet. Ausbeute: 5,5 g (87 %) farbloser Kristalle; Smp.: 135-136°C.

25

Beispiel 4: 3-Chlor-2-[1-(4-chlorphenyl)-1-methoxycarbonylmethyl]-5-trifluormethylpyridin (Verfahren B)

In eine Lösung von 3,0 g 2-[1-Carbamoyl-1-(4-chlorphenyl)-methyl]-3-chlor-5-trifluormethylpyridin (hergestellt nach Beispiel 3) in 100 ml wasserfreiem Methanol wurde 5 Stunden Chlorwasserstoff-Gas eingeleitet. Anschließend rührte man noch 16 Stunden, wobei überschüssiger Chlorwasserstoff durch Einleiten von Stickstoff entfernt wurde. Nach Abtrennen des Methanols reinigte man das Rohprodukt mittels Chromatographie an Kieselgel (Laufmittel: Cyclohexan/tert.-Butyl-methylether = 50:1). Ausbeute: 1,3 g (42 %) farbloser Kristalle; Smp.: 103-104°C.

Beispiel 5: 3-Chlor-2-(4-chlorbenzyl)-5-trifluormethylpyridin (Verfahren C)

4,3 g 3-Chlor-2-[1-(4-chlorphenyl)-1-cyanomethyl]-5-trifluormethylpyridin (hergestellt nach Beispiel 1) wurden 3 Stunden in 50 ml 47%iger wässriger Bromwasserstoff-Lösung auf Rückfluß-temperatur erhitzt und dann noch 68 Stunden bei 23°C gerührt. Anschließend gab man den Ansatz in 500 ml Eiswasser. Nach weiteren 30 Minuten Rühren wurde der entstandene Feststoffanteil

abgetrennt, mit Wasser gewaschen und schließlich getrocknet.
Ausbeute: 3,0 g (75 %) farbloser Kristalle; Smp.: 54-56°C).

Beispiel 6: 3-Chlor-2-(2,3-dichlorbenzyl)-5-trifluormethylpyridin
5 (Verfahren C)

Analog Beispiel 5 erhielt man aus 7,9 g 3-Chlor-2-[1-(2,3-dichlorphenyl)-1-cyanomethyl]-5-trifluormethylpyridin (hergestellt nach Beispiel 2) 6,3 g eines farblosen Öls. Ausbeute: 86 %;

10 $^1\text{H-NMR}$ (270 MHz; in CDCl_3): δ [ppm] = 4,50 (s, 2H), 7,02 (d, 1H), 7,15 (t, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,93 (s, 1H), 8,67 (s, 1H).

Beispiel 7: 3-Chlor-2-(4-chlorbenzoyl)-5-trifluormethylpyridin

15 3,0 g einer 80%igen Suspension von Natriumhydrid in Mineralöl wurden zur Entfernung des Mineralöls mit wasserfreiem Dioxan gewaschen. Zu dem erhaltenen Natriumhydrid gab man erst 100 ml Dioxan und dann unter Stickstoff-Atmosphäre nacheinander 21,6 g 2,3-Dichlor-5-trifluormethylpyridin, 14,1 g p-Chlorbenzaldehyd
20 und 2,24 g 1,3-Dimethylimidazoliumiodid. Dieses Reaktionsgemisch wurde eine Stunde bei 50°C und 65 Stunden bei 23°C gerührt. Zur Aufarbeitung verdünnte man mit 200 ml Wasser, wonach auf die Hälfte des Volumens eingeeengt wurde. Anschließend extrahierte man das Produkt mit dreimal 50 ml Methylenchlorid. Die ver-
25 einigten organischen Phasen wurden mit 50 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und schließlich eingeeengt. Die Reinigung des Rohproduktes erfolgte mittels Vakuumdestillation. Ausbeute: 22,4 g (70 %) einer gelben Flüssigkeit; Siedebereich: 126-139°C/0,65 mbar; Reinheit: 95 %;
30 $^1\text{H-NMR}$ (270 MHz; in CDCl_3): δ [ppm] = 7,48 (d, 2H), 7,79 (d, 2H), 8,12 (s, 1H), 8,83 (s, 1H).

Beispiel 8: 3-Chlor-2-(4-chlorbenzoyl)-5-trifluormethylpyridin
35 (Verfahren D)

Zu einer Lösung von 2,0 g 3-Chlor-2-[1-(4-chlorphenyl)-1-cyanomethyl]-5-trifluormethylpyridin (hergestellt nach Beispiel 1) in 20 ml Dimethylsulfoxid wurde eine Lösung von 2,0 g Kaliumcarbonat in 3 ml Wasser gegeben, wonach man unter Luftzutritt drei Tage
40 bei 23°C rührte. Zur Aufarbeitung wurde die Reaktionsmischung in 200 ml Wasser gegossen. Danach extrahierte man das Wertprodukt mit dreimal 80 ml tert.-Butyl-methylether. Die vereinigten organischen Phasen wurden zweimal mit je 50 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und schließlich eingeeengt.
45 Die Reinigung des erhaltenen schwarzen Öls erfolgte mittels Kugelrohrdestillation unter Vakuum. Ausbeute: 1,2 g (62 %) eines hellgelben Öls; Siedebereich: 110-120°C (0,3 mbar);

¹H-NMR siehe Bsp. 7.

Beispiel 9: 3-Chlor-2-(4-chlorbenzoyl)-5-trifluormethylpyridin
(Verfahren A+D)

5

16,5 g einer 80%igen Suspension von Natriumhydrid in Mineralöl wurden zur Entfernung des Mineralöls mit wasserfreiem N,N-Dimethylformamid gewaschen. Danach versetzte man das Natriumhydrid mit 100 ml N,N-Dimethylformamid und danach tropfenweise mit einer

- 10 Lösung von 37,9 g 4-Chlorbenzylcyanid in 100 ml N,N-Dimethylformamid (exotherm). Nach beendeter Zugabe wurde noch 15 Minuten gerührt. Anschließend tropfte man 54,0 g 2,3-Dichlor-5-trifluormethylpyridin in die Reaktionsmischung, die sich dabei stark erwärmte und durch externe Kühlung auf etwa 50°C gehalten wurde.
- 15 Nach beendeter Zugabe rührte man noch 20 Stunden bei 23°C. Danach wurde 4 Tage lang (über Blaugel getrocknete) Luft durch die Mischung geleitet. Zur Aufarbeitung goß man das Reaktionsgemisch in 600 ml Eiswasser. Danach extrahierte man das Wertprodukt mit dreimal 200 ml tert.-Butyl-methylether. Die vereinigten organi-
- 20 schen Phasen wurden zweimal mit je 100 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und schließlich eingeeengt. Die Reinigung des Rohproduktes erfolgte mittels Chromatographie an Kieselgel (Laufmittel: Cyclohexan/tert.-Butyl-methylether = 9:1). Ausbeute: 50,1 g (62 %) eines hellgelben Öls; Reinheit (GC): 94,6 %;
- 25 ¹H-NMR siehe Bsp. 7.

Beispiel 10: 3-Chlor-2-[1-(4-chlorphenyl)-1-hydroxymethyl]-5-trifluormethylpyridin (Verfahren E)

- 30 Zu einer Lösung von 6,0 g 3-Chlor-2-(4-chlorbenzoyl)-5-trifluormethylpyridin in 10 ml wasserfreiem Ethanol wurden unter Eiskühlung portionsweise 0,36 g Natriumborhydrid gegeben. Nach 20 Stunden Rühren bei 23°C tropfte man vorsichtig 50 ml 10%ige Salzsäure in die Reaktionsmischung. Anschließend wurde das
- 35 Ethanol abgedampft. Danach extrahierte man das Produkt mit dreimal 30 ml tert.-Butyl-methylether. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet und dann eingeeengt. Die Reinigung des Rohproduktes erfolgte mittels Chromatographie an Kieselgel (Laufmittel: Cyclohexan/tert.-Butyl-methylether =
- 40 9:1). Ausbeute: 3,6 g (60 %) eines farblosen Öls;
¹H-NMR (270 MHz; in CDCl₃): δ [ppm] = 5,02 (d,1H), 6,02 (d,1H), 7,33-7,41 (m,4H), 7,91 (s,1H), 8,81 (s,1H).

Beispiel 11: 3-Chlor-2-[1-(4-chlorphenyl)-1-methoxymethyl]-5-trifluormethylpyridin (Verfahren E)

- 0,2 g einer 80%igen Suspension von Natriumhydrid in Mineralöl
5 wurden zur Entfernung des Mineralöls mit wasserfreiem N,N-Dimethylformamid gewaschen. Zunächst versetzte man das Natriumhydrid mit 50 ml N,N-Dimethylformamid und danach tropfenweise mit einer Lösung von 2,1 g 3-Chlor-2-[1-(4-chlorphenyl)-1-hydroxymethyl]-5-trifluormethylpyridin in 10 ml N,N-Dimethylformamid.
10 Anschließend wurde noch 15 Minuten nachgerührt. Nach Zutropfen von 1,1 g Methyljodid rührte man weitere 20 Stunden bei 23°C. Danach wurde die Reaktionsmischung in 200 ml Eiswasser gegossen. Aus der wässrigen Phase extrahierte man das Produkt mit dreimal 70 ml tert.-Butyl-methylether. Die vereinigten organischen Phasen
15 wurden zweimal mit je 50 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und schließlich eingeeengt. Die Reinigung des Rohproduktes erfolgte mittels Chromatographie an Kieselgel (Laufmittel: Cyclohexan/tert.-Butyl-methylether = 100:1). Ausbeute: 1,1 g (50 %) eines farblosen Öls.
20 ¹H-NMR (270 MHz; in CDCl₃): δ [ppm] = 3,44 (s,3H), 5,83 (s,1H), 7,33 (d,2H), 7,48 (d,2H), 7,90 (s,1H), 8,85 (s,1H).

Beispiel 12: 3-Chlor-2-(4-chlorbenzoyl)-5-trifluormethylpyridin (Verfahren F)

- 25 Zu einer Suspension von 3,0 g Natriumhydrid (80 gew.-%ige Suspension in Mineralöl) in 100 ml wasserfreiem Dioxan wurden nacheinander unter Rühren 21,6 g 2,3-Dichlor-5-trifluormethylpyridin, 14,1 g 4-Chlorbenzaldehyd und 2,24 g 1,3-Dimethyl-
30 imidazoliumiodid gegeben. Anschließend rührte man (unter Stickstoff-Atmosphäre) 11 Stunden bei 50°C und dann 60 Stunden bei 22°C. Nach Verdünnen der Reaktionsmischung mit 200 ml Wasser wurde das Dioxan bei reduziertem Druck weitgehend abdestilliert. Aus dem Rückstand extrahierte man das Produkt mit dreimal 100 ml
35 Methylenechlorid. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit 50 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und schließlich eingeeengt. Destillation des Rückstandes bei 0,65 mbar (Siedebereich: 126-139°C) ergab 22,4 g eines farblosen Öls. Ausbeute: 70 % (Reinheit: ca. 95 %); ¹H-NMR siehe Bsp. 7.

40

45

Beispiel 13: 3-Chlor-2-[1-(2,3-dichlor-4-methoxyphenyl)-1-cyanomethyl]-5-trifluormethylpyridin (Verfahren A)

Vorstufe: 2,3-Dichlor-4-methoxybenzylbromid

- 5 55,0 g 2,3-Dichloranisol wurden in 155 ml Eisessig bei 30°C gelöst und mit 9,6 g Paraformaldehyd versetzt. Danach gab man 65 ml einer 30 gew.-%igen Lösung von HBr in Eisessig zu, wonach 5 Stunden bei 90°C gerührt wurde. Anschließend ließ man die Reaktions-
- 10 mischung abkühlen und goß sie dann in 800 ml Eiswasser. Das kristallisierte Rohprodukt wurde abgetrennt, mit Wasser gewaschen und aus n-Hexan umkristallisiert. Ausbeute: 21 g (78 %) weißer Kristalle; Smp.: 101-102°C.

15 Vorstufe: 2,3-Dichlor-4-methoxybenzylcyanid

- Zu einer Suspension von 15 g wasserfreiem Natriumcyanid in 250 ml wasserfreiem Dimethylsulfoxid wurde unter Rühren eine Lösung von 68 g 2,3-Dichlor-4-methoxybenzylbromid in 220 ml Dimethylsulfoxid
- 20 getropft. Anschließend erhitze man 5 Stunden unter Stickstoffatmosphäre auf Rückflußtemperatur. Die erkaltete Reaktionsmischung wurde in 1,5 l Eiswasser gegossen, wonach man das entstandene feste Produkt abtrennte, mit Wasser wusch und durch Verrühren mit Petrolether (bei 40-60°C) reinigte. Ausbeute: 51 g
- 25 (94 %) weißer Kristalle; Smp.: 118-119°C.

- Analog zu Beispiel 1 erhielt man unter Verwendung von 38,9 g 2,3-Dichlor-5-trifluormethylpyridin, 38,9 g 2,3-Dichlor-4-methoxybenzylnitril, 5,95 g einer 80 gew.-%igen Natriumhydrid-
- 30 Suspension in Mineralöl und 220 ml Dimethylformamid 39,2 g weißer Kristalle. Ausbeute: 55 %; Smp.: 174-176°C.

Beispiel 14: 3-Chlor-2-[2,3-dichlor-4-hydroxybenzyl]-5-trifluormethylpyridin (Verfahren C)

- 35 Analog zu Beispiel 5 erhielt man aus 38 g 3-Chlor-2-[1-(2,3-dichlor-4-methoxyphenyl)-1-cyanomethyl]-5-trifluormethylpyridin 20 g Wertprodukt (weiße Kristalle). Ausbeute: 60 %; Smp.: 159-161°C.

40 Beispiel 15: 2-[2,3-Dichlor-4-([3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl]-methyl)-phenoxy]-essigsäuremethylester

- 2,0 g 3-Chlor-2-(2,3-dichlor-4-hydroxybenzyl)-5-trifluormethyl-
- 45 pyridin, 1,5 g wasserfreies Kaliumcarbonat und 1,0 g Bromessigsäuremethylester wurden in 60 ml wasserfreiem Dimethylformamid 16 Stunden bei 23°C gerührt. Danach goß man die Reaktionsmischung

in 400 ml Eiswasser. Das entstandene feste Produkt wurde abgetrennt, mit Wasser gewaschen und durch Verrühren in n-Hexan gereinigt. Ausbeute: 2,4 g (100 %; weiße Kristalle); Smp.: 110-111°C.

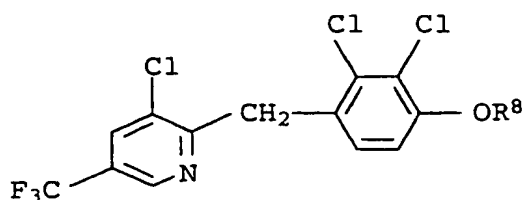
5

In den folgenden Tabellen 1 und 2 sind neben den vorstehend beschriebenen Verbindungen noch weitere substituierte 2-Benz(o)ylpyridine I aufgeführt, die ebenfalls nach einem der beschriebenen Verfahren hergestellt wurden oder herstellbar sind:

10

Tabelle 1

15



I {n = 0; X = CH₂;
R¹ = CF₃; R², R³, R⁴ = Cl;
R⁵ = OR⁸; R⁶, R⁷ = H}

20

25

30

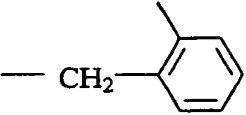
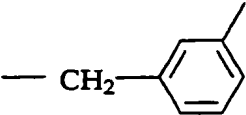
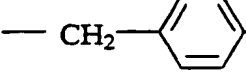
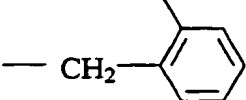
35

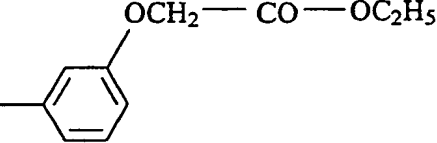
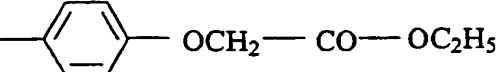
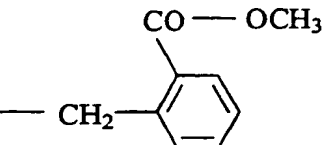
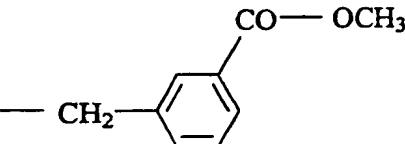
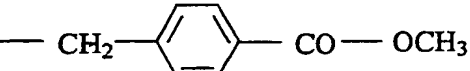
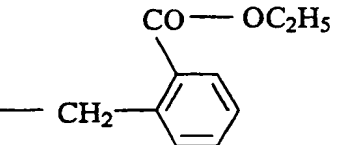
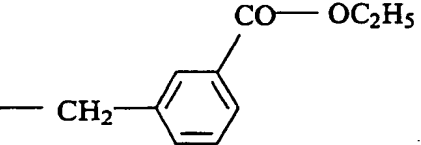
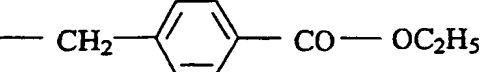
40

45

Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
1	-H	
2	-CH ₃	88°C
3	-C ₂ H ₅	
4	-CH ₂ -C ₂ H ₅	
5	-CH(CH ₃) ₂	
6	-CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
7	-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	
8	-CH(CH ₃)-C ₂ H ₅	
9	-C(CH ₃) ₃	
10	-CH ₂ .CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
11	Cyclopropyl	
12	Cyclobutyl	
13	Cyclopentyl	
14	Cyclohexyl	
15	-CF ₃	
16	-CHF ₂	
17	-CH ₂ -CN	
18	-CH ₂ -CH ₂ -CN	
19	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CN	
20	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CN	
21	-CH ₂ -OCH ₃	
22	-CH ₂ -OC ₂ H ₅	
23	-CH ₂ -OCH ₂ -C ₂ H ₅	
24	-CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	

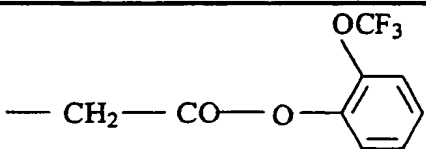
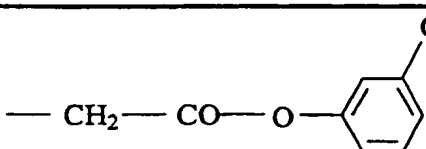
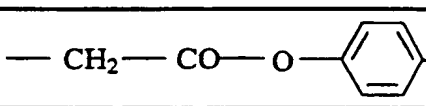
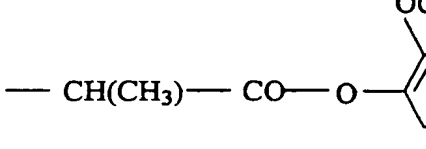
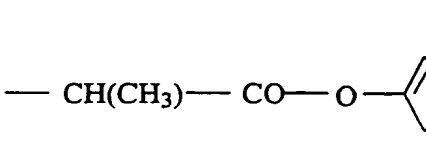
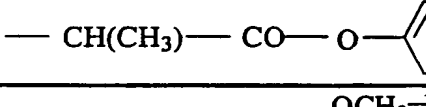
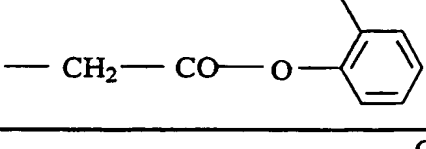
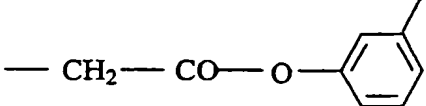
Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
25	-CH ₂ -OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
5	26 -CH ₂ -OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅	
27	-CH ₂ -OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂	
28	-CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	
29	-CH ₂ -OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
30	-CH ₂ -SCH ₃	
10	31 -CH ₂ -SC ₂ H ₅	
32	-CH ₂ -SCH ₂ -C ₂ H ₅	
33	-CH ₂ -SCH(CH ₃) ₂	
34	-CH ₂ -SCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
15	35 -CH ₂ -SCH ₂ -CH(CH ₃) ₂	
36	-CH ₂ -SCH(CH ₃)-C ₂ H ₅	
37	-CH ₂ -SC(CH ₃) ₃	
38	-CH ₂ -SCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
39	-CH ₂ -SO-CH ₃	
20	40 -CH ₂ -SO-C ₂ H ₅	
41	-CH ₂ -SO-CH ₂ -C ₂ H ₅	
42	-CH ₂ -SO-CH(CH ₃) ₂	
43	-CH ₂ -SO-CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
25	44 -CH ₂ -SO-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	
45	-CH ₂ -SO-CH(CH ₃)-C ₂ H ₅	
46	-CH ₂ -SO-C(CH ₃) ₃	
47	-CH ₂ -SO-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
48	-CH ₂ -SO ₂ -CH ₃	
30	49 -CH ₂ -SO ₂ -C ₂ H ₅	
50	-CH ₂ -SO ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
51	-CH ₂ -SO ₂ -CH(CH ₃) ₂	
52	-CH ₂ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
35	53 -CH ₂ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	
54	-CH ₂ -SO ₂ -CH(CH ₃)-C ₂ H ₅	
55	-CH ₂ -SO ₂ -C(CH ₃) ₃	
56	-CH ₂ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
57	-CH ₂ -CH = CH ₂	88°C
40	58 -CH(CH ₃)-CH = CH ₂	
59	-CH ₂ -C(CH ₃) = CH ₂	
60	-CH ₂ -CH = CH-CH ₃	
61	-CH ₂ -CH = C(CH ₃) ₂	
45	62 -CH ₂ -CH ₂ -CH = CH ₂	
63	-CH ₂ -CH ₂ -CH = CH-CH ₃	
64	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) = CH ₂	

Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
65	-CH ₂ -CH ₂ -C = C(CH ₃) ₂	
5	66 Cyclopent-2-en-1-yl	
67	Cyclohex-2-en-1-yl	
68	-CH ₂ -CH = CHCl	
69	-CH ₂ -C(Cl) = CH ₂	
10	70 -CH ₂ -CH = CCl ₂	
71	-CH ₂ -C(Cl) = CHCl	
72	-CH ₂ -C(Cl) = CCl ₂	
73	-CH ₂ -C ≡ CH	91°C
74	-CH(CH ₃)-C ≡ CH	
15	75 -CH ₂ -C ≡ C-CH ₃	
76	Benzyl	
77	o-Chlorbenzyl	
78	m-Chlorbenzyl	
79	p-Chlorbenzyl	
20	80 o-Methylbenzyl	
81	m-Methylbenzyl	
82	p-Methylbenzyl	
83	o-(OCH ₃)benzyl	
25	84 m-(OCH ₃)benzyl	
85	p-(OCH ₃)benzyl	
86	o-(OCF ₃)benzyl	
87	m-(OCF ₃)benzyl	
88	p-(OCF ₃)benzyl	
30	<div> <div>OCH₂—CO—OCH₃</div> <div>  </div> </div>	
35	<div> <div>OCH₂—CO—OCH₃</div> <div>  </div> </div>	
40	<div> <div>—CH₂—</div> <div>  </div> <div>OCH₂—CO—OCH₃</div> </div>	
45	<div> <div>OCH₂—CO—OC₂H₅</div> <div>  </div> </div>	

Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5 93		
10 94		
95	o-Nitrophenyl	
96	m-Nitrophenyl	
97	p-Nitrophenyl	
98	o-Cyanophenyl	
15 99	m-Cyanophenyl	
100	p-Cyanophenyl	
20 101		
25 102		
103		
30 104		
35 105		
40 106		
107	-CH ₂ -CO-OH	
108	-CH ₂ -CO-OCH ₃	111°C
109	-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	
110	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅	
45 111	-CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	
112	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
113	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂	

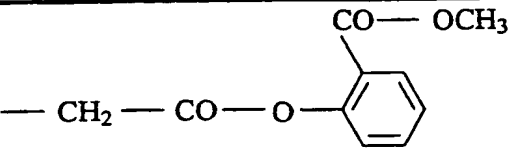
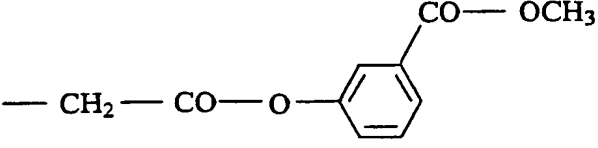
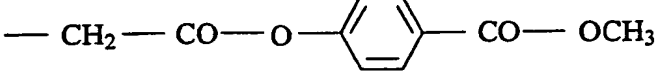
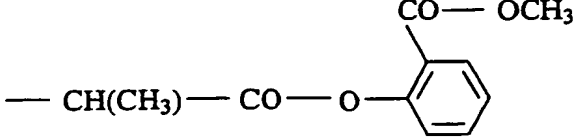
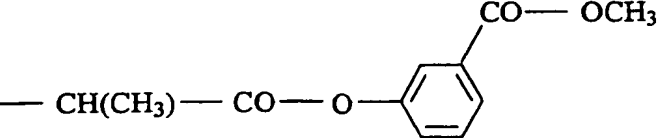
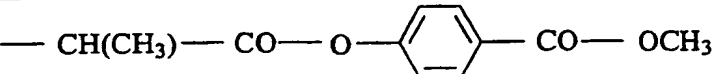
	Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5	114	-CH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅	
	115	-CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	
	116	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
	117	-CH(CH ₃)-CO-OH	
	118	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃	Ol
10	119	-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅	
	120	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅	
	121	-CH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃) ₂	
	122	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
	123	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂	
15	124	-CH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅	
	125	-CH(CH ₃)-CO-OC(CH ₃) ₃	
	126	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
	127	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH=CH ₂	
	128	-CH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CH=CH ₂	
20	129	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	
	130	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH=CH-CH ₃	
	131	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH=C(CH ₃) ₂	
	132	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃) ₂	
	133	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH=CH ₂	
25	134	-CH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CH=CH ₂	
	135	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	
	136	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH=CH-CH ₃	
	137	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH=C(CH ₃) ₂	
	138	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃) ₂	
30	139	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C≡CH	
	140	-CH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-C≡CH	
	141	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C≡C-CH ₃	
	142	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C≡CH	
	143	-CH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-C≡CH	
35	144	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C≡C-CH ₃	
	145	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -OCH ₃	
	146	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅	
	147	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -OCH ₂ -C ₂ H ₅	
	148	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	
40	149	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -OCH ₃	
	150	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅	
	151	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -OCH ₂ -C ₂ H ₅	
	152	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	
	153	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CF ₃	

	Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5	154	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CF ₃	
	155	-CH ₂ -CO-O-cyclopropyl	
	156	-CH ₂ -CO-O-cyclobutyl	
	157	-CH ₂ -CO-O-cyclopentyl	
	158	-CH ₂ -CO-O-cyclohexyl	
10	159	-CH(CH ₃)-CO-O-cyclopropyl	
	160	-CH(CH ₃)-CO-O-cyclobutyl	
	161	-CH(CH ₃)-CO-O-cyclopentyl	
	162	-CH(CH ₃)-CO-O-cyclohexyl	
	163	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OCH ₃	
15	164	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	
	165	-CH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃	
	166	-CH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅	
	167	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₃	
	168	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	
20	169	-CH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃	
	170	-CH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅	
	171	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH=CH ₂	
	172	-CH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH=CH ₂	
	173	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH=CH ₂	
25	174	-CH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH=CH ₂	
	175	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -C≡CH	
	176	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-C≡CH	
	177	-CH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C≡CH	
	178	-CH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-C≡CH	
30	179	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -C≡CH	
	180	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-C≡CH	
	181	-CH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C≡CH	
	182	-CH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-C≡CH	
	183	-CH ₂ -CO-OCH ₂ -COOH	
35	184	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -COOH	
	185	-CH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-COOH	
	186	-CH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-COOH	
	187	-CH ₂ -CO-O-(oxetan-3-yl)	
	188	-CH(CH ₃)-CO-O-(oxetan-3-yl)	
40	189	-CH ₂ -CO-O-phenyl	
	190	-CH(CH ₃)-CO-O-phenyl	
	191	-CH ₂ -CO-O-(o-chlorophenyl)	
	192	-CH ₂ -CO-O-(m-chlorophenyl)	
	193	-CH ₂ -CO-O-(p-chlorophenyl)	

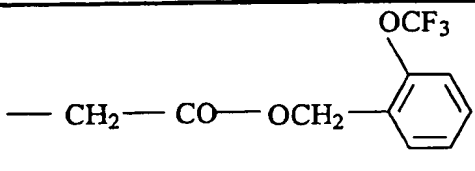
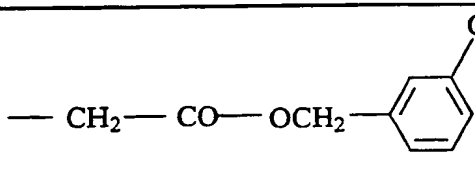
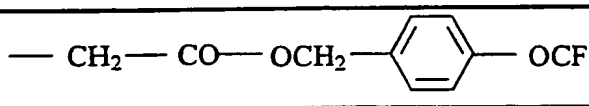
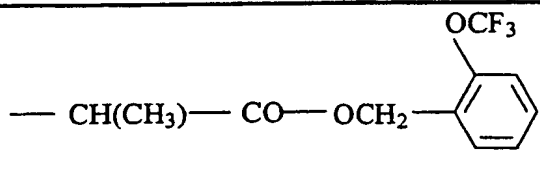
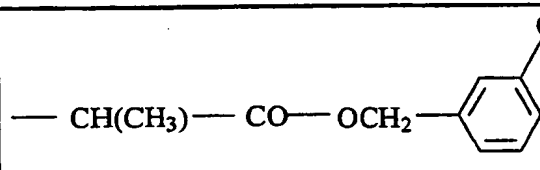
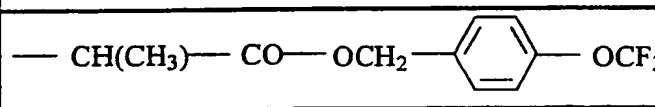
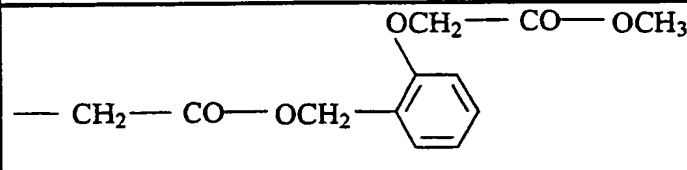
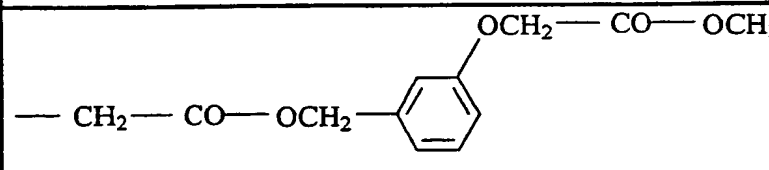
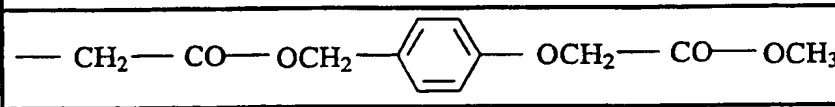
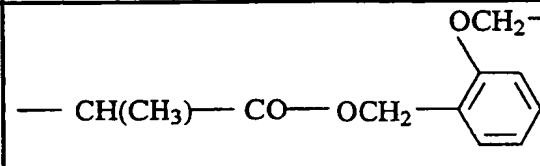
Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
194	-CH(CH ₃)-CO-O-(o-chlorophenyl)	
195	-CH(CH ₃)-CO-O-(m-chlorophenyl)	
196	-CH(CH ₃)-CO-O-(p-chlorophenyl)	
197	-CH ₂ -CO-O-(o-methylphenyl)	
198	-CH ₂ -CO-O-(m-methylphenyl)	
199	-CH ₂ -CO-O-(p-methylphenyl)	
200	-CH(CH ₃)-CO-O-(o-methylphenyl)	
201	-CH(CH ₃)-CO-O-(m-methylphenyl)	
202	-CH(CH ₃)-CO-O-(p-methylphenyl)	
203		
204		
205		
206		
207		
208		
209		
210		

Nr.	$-R^8$	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5	211 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2-\text{CO}-\text{OCH}_3$	
10	212 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2-\text{CO}-\text{OCH}_3$	
15	213 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2-\text{CO}-\text{OCH}_3$	
20	214 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2-\text{CO}-\text{OCH}_3$	
25	215 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{OCH}_3$	
30	216 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{OCH}_3$	
35	217 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{OCH}_3$	
40	218 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{OCH}_3$	
45	219 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{OCH}_3$	
220	$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{OCH}_3$	
221	$-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{O}-(\text{o-nitrophenyl})$	
222	$-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{O}-(\text{m-nitrophenyl})$	
223	$-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{O}-(\text{p-nitrophenyl})$	
224	$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{O}-(\text{o-nitrophenyl})$	
225	$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{O}-(\text{m-nitrophenyl})$	
226	$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{O}-(\text{p-nitrophenyl})$	

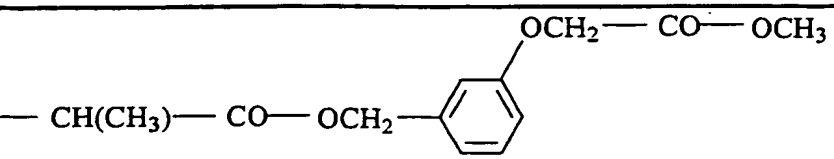
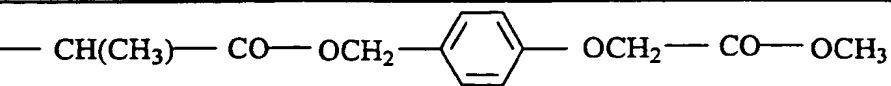
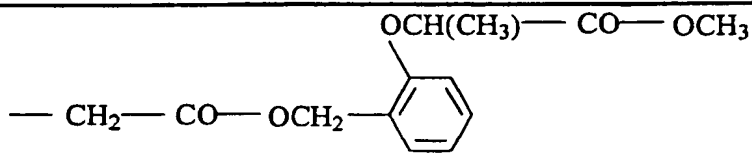
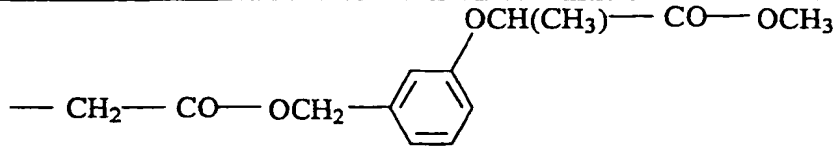
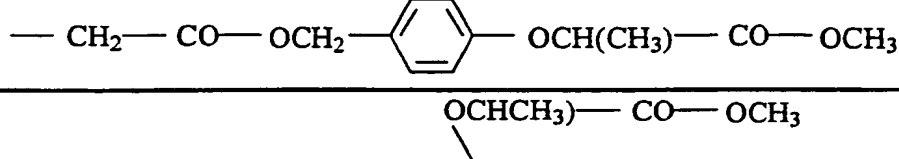
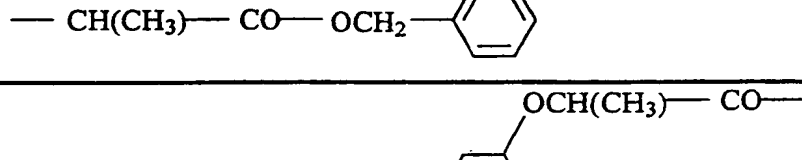
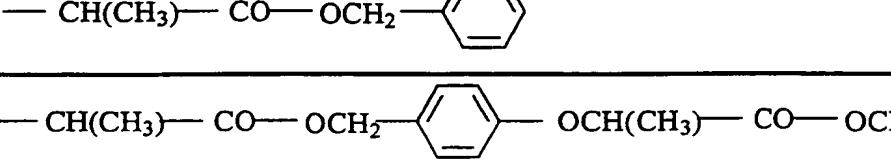
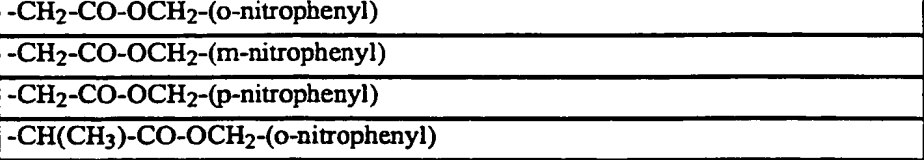
50

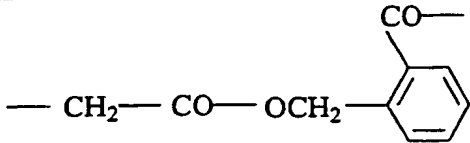
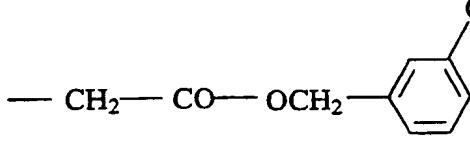
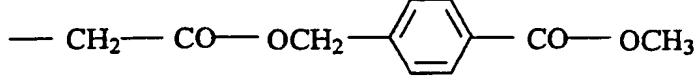
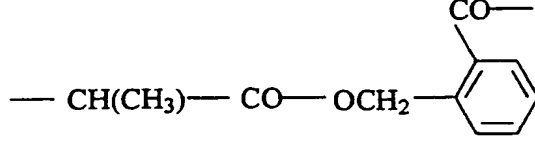
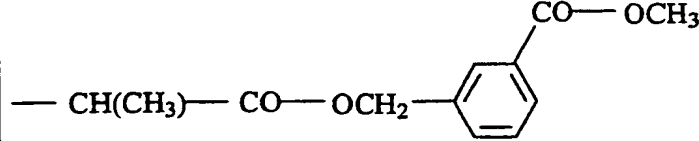
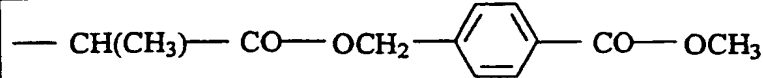
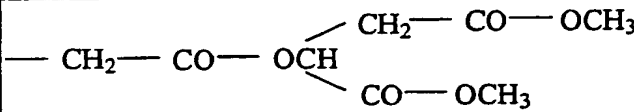
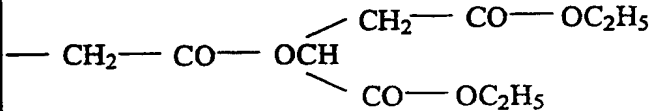
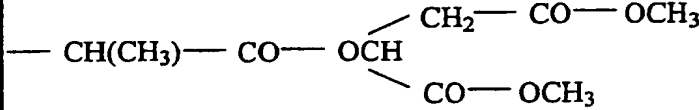
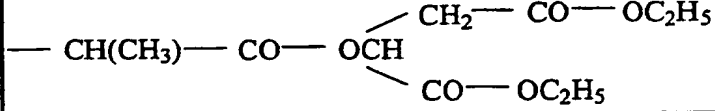
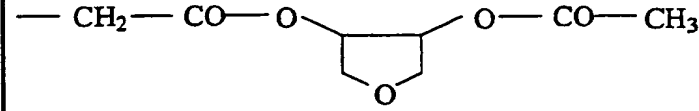
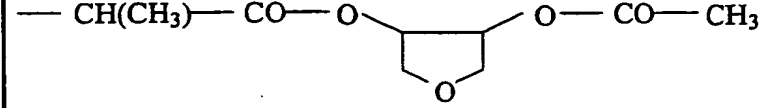
Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5	227 -CH ₂ -CO-O-(o-cyanophenyl)	
	228 -CH ₂ -CO-O-(m-cyanophenyl)	
	229 -CH ₂ -CO-O-(p-cyanophenyl)	
	230 -CH(CH ₃)-CO-O-(o-cyanophenyl)	
	231 -CH(CH ₃)-CO-O-(m-cyanophenyl)	
10	232 -CH(CH ₃)-CO-O-(p-cyanophenyl)	
	233 	
	234 	
	235 	
	236 	
25	237 	
	238 	
	239 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -phenyl	
	240 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -phenyl	
	241 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(o-chlorophenyl)	
35	242 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(m-chlorophenyl)	
	243 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(p-chlorophenyl)	
	244 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(o-chlorophenyl)	
	245 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(m-chlorophenyl)	
	246 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(p-chlorophenyl)	
40	247 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(o-methylphenyl)	
	248 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(m-methylphenyl)	
	249 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(p-methylphenyl)	
	250 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(o-methylphenyl)	
	251 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(m-methylphenyl)	

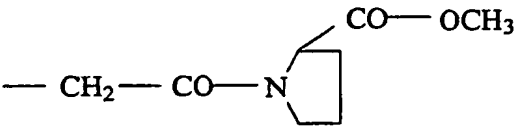
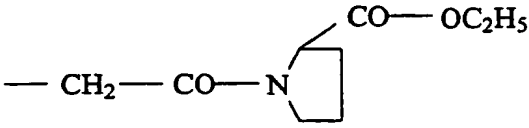
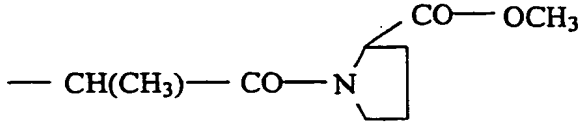
51

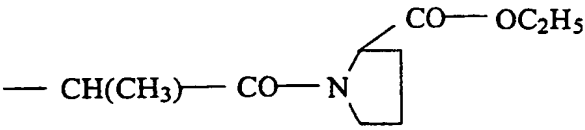
Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
252	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(p-methylphenyl)	
5 253		
10 254		
15 255		
20 256		
25 257		
258		
30 259		
35 260		
261		
40 262		

52

Nr.	$-R^8$	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5	263 	
	264 	
10	265 	
	266 	
15	267 	
	268 	
20	269 	
	270 	
35	271 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(o-nitrophenyl)	
	272 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(m-nitrophenyl)	
	273 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(p-nitrophenyl)	
	274 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(o-nitrophenyl)	
	275 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(m-nitrophenyl)	
40	276 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(p-nitrophenyl)	
	277 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(o-cyanophenyl)	
	278 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(m-cyanophenyl)	
	279 -CH ₂ -CO-OCH ₂ -(p-cyanophenyl)	
	280 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(o-cyanophenyl)	
45	281 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(m-cyanophenyl)	
	282 -CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -(p-cyanophenyl)	

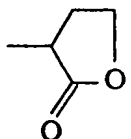
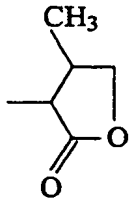
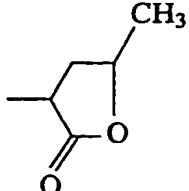
Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5 283		
10 284		
15 285		
20 286		
20 287		
25 288		
30 289		
30 290		
35 291		
40 292		
293		
45 294		

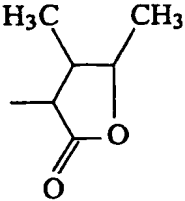
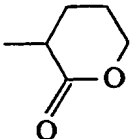
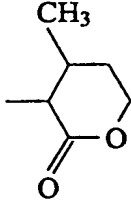
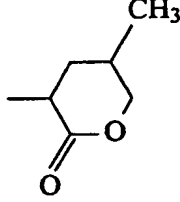
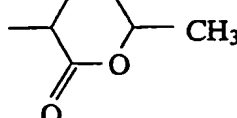
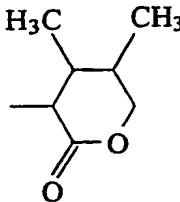
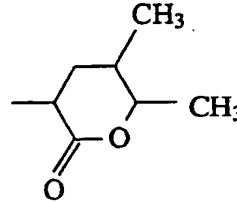
Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5	295 -CH ₂ -CO-NH ₂	
	296 -CH(CH ₃)-CO-NH ₂	
	297 -CH ₂ -CO-NH(CH ₃)	
	298 -CH(CH ₃)-CO-NH(CH ₃)	
	299 -CH ₂ -CO-N(CH ₃) ₂	
10	300 -CH(CH ₃)-CO-N(CH ₃) ₂	
	301 -CH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃	
	302 -CH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	
	303 -CH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃	
	304 -CH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅	
15	305 -CH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃	
	306 -CH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	
	307 -CH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃	
	308 -CH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅	
	309 -CH ₂ -CO-N(CH ₃)-phenyl	
20	310 -CH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-phenyl	
	311 -CH ₂ -CO-NH-phenyl	
	312 -CH(CH ₃)-CO-NH-phenyl	
	313 -CH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -phenyl	
	314 -CH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -phenyl	
25	315 -CH ₂ -CO-NH-CH ₂ -phenyl	
	316 -CH(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -phenyl	
	317 -CH ₂ -CO-(pyrrolidin-1-yl)	
	318 -CH(CH ₃)-CO-(pyrrolidin-1-yl)	
	319 -CH ₂ -CO-(piperidin-1-yl)	
30	320 -CH(CH ₃)-CO-(piperidin-1-yl)	
	321 -CH ₂ -CO-(morpholin-4-yl)	
	322 -CH(CH ₃)-CO-(morpholin-4-yl)	
35	323 	
40	324 	
45	325 	

Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5 326		
327	-CH ₂ -CO-H	
328	-CH ₂ -CO-CH ₃	
10 329	-CH(CH ₃)-CO-H	
330	-CH(CH ₃)-CO-CH ₃	
331	-CH ₂ -CH = N-OH	
332	-CH(CH ₃)-CH = N-OH	
15 333	-CH ₂ -C(CH ₃) = N-OH	
334	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) = N-OH	
335	-CH ₂ -CH = N-OCH ₃	
336	-CH(CH ₃)-CH = N-OCH ₃	
337	-CH ₂ -C(CH ₃) = N-OCH ₃	
20 338	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) = N-OCH ₃	
339	-CH ₂ -CH = N-OCH ₂ -CH = CH ₂	
340	-CH(CH ₃)-CH = N-OCH ₂ -CH = CH ₂	
341	-CH ₂ -C(CH ₃) = N-OCH ₂ -CH = CH ₂	
25 342	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) = N-OCH ₂ -CH = CH ₂	
343	-CH ₂ -CH = N-OCH ₂ -CO-OCH ₃	
344	-CH ₂ -CH = N-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	
345	-CH(CH ₃)-CH = N-OCH ₂ -CO-OCH ₃	
346	-CH(CH ₃)-CH = N-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	
30 347	-CH ₂ -C(CH ₃) = N-OCH ₂ -CO-OCH ₃	
348	-CH ₂ -C(CH ₃) = N-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	
349	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) = N-OCH ₂ -CO-OCH ₃	
350	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) = N-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	
35 351	-CH ₂ -CH = N-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃	
352	-CH ₂ -CH = N-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅	
353	-CH(CH ₃)-CH = N-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃	
354	-CH(CH ₃)-CH = N-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅	
355	-CH ₂ -C(CH ₃) = N-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃	
40 356	-CH ₂ -C(CH ₃) = N-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅	
357	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) = N-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃	
358	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) = N-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅	
359	-CH ₂ -CO-CO-OCH ₃	
45 360	-CH ₂ -CO-CO-OC ₂ H ₅	
361	-CH ₂ -CO-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅	
362	-CH ₂ -CO-CO-OCH(CH ₃) ₂	

	Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5	363	-CH ₂ -CO-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅	
	364	-CH ₂ -CO-CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂	
	365	-CH ₂ -CO-CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅	
	366	-CH ₂ -CO-CO-OC(CH ₃) ₃	
	367	-CH(CH ₃)-CO-CO-OCH ₃	
10	368	-CH(CH ₃)-CO-CO-OC ₂ H ₅	
	369	$\begin{array}{c} \text{N} - \text{OCH}_3 \\ \\ \text{--- CH}_2\text{--- C --- CO --- OCH}_3 \end{array}$	113°C
15	370	$\begin{array}{c} \text{N} - \text{OCH}_3 \\ \\ \text{--- CH}_2\text{--- C --- CO --- OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	
	371	$\begin{array}{c} \text{N} - \text{OC}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{--- CH}_2\text{--- C --- CO --- OCH}_3 \end{array}$	
20	372	$\begin{array}{c} \text{N} - \text{OC}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{--- CH}_2\text{--- C --- CO --- OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	
	373	$\begin{array}{c} \text{N} - \text{OCH}_2 - \text{CH} = \text{CH}_2 \\ \\ \text{--- CH}_2\text{--- C --- CO --- OCH}_3 \end{array}$	
25	374	$\begin{array}{c} \text{N} - \text{OCH}_2 - \text{CH} = \text{CH}_2 \\ \\ \text{--- CH}_2\text{--- C --- CO --- OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	
	375	$\begin{array}{c} \text{N} - \text{OCH}_2 - \text{phenyl} \\ \\ \text{--- CH}_2\text{--- C --- CO --- OCH}_3 \end{array}$	
30	376	$\begin{array}{c} \text{N} - \text{OCH}_2 - \text{phenyl} \\ \\ \text{--- CH}_2\text{--- C --- CO --- OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	
	377	$\begin{array}{c} \text{N} - \text{OCH}_3 \\ \\ \text{--- CH(CH}_3\text{)--- C --- CO --- OCH}_3 \end{array}$	
40	378	$\begin{array}{c} \text{N} - \text{OC}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{--- CH(CH}_3\text{)--- C --- CO --- OCH}_3 \end{array}$	
	379	$\begin{array}{c} \text{N} - \text{OCH}_3 \\ \\ \text{--- CH(CH}_3\text{)--- C --- CO --- OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	
45			

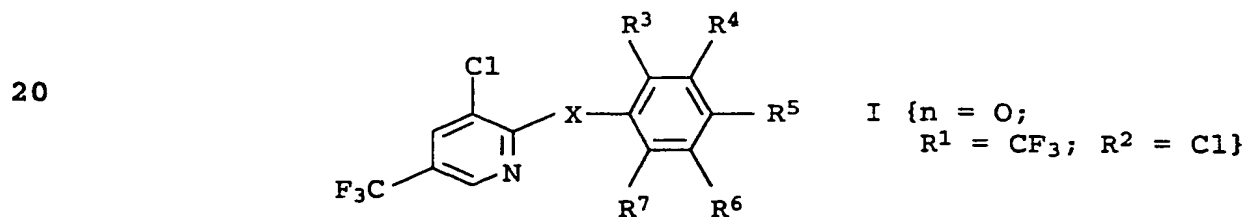
Nr.	$-R^8$	Fp./ 1H -NMR (in $CDCl_3$) [ppm]
5 380	$\begin{array}{c} N-OC_2H_5 \\ \\ -CH(CH_3)-C-CO-OC_2H_5 \end{array}$	
10 381	$\begin{array}{c} N-OCH_2-CH=CH_2 \\ \\ -CH(CH_3)-C-CO-OCH_3 \end{array}$	
382	$\begin{array}{c} N-OCH_2-CH=CH_2 \\ \\ -CH(CH_3)-C-CO-OC_2H_5 \end{array}$	
15 383	$\begin{array}{c} N-OCH_2-phenyl \\ \\ -CH(CH_3)-C-CO-OCH_3 \end{array}$	
20 384	$\begin{array}{c} N-OCH_2-phenyl \\ \\ -CH(CH_3)-C-CO-OC_2H_5 \end{array}$	
385	$\begin{array}{c} OCH_3 \\ \\ -CH_2-CO-N- \\ \\ CH_2-CO-OCH_3 \end{array}$	
25 386	$\begin{array}{c} OCH_3 \\ \\ -CH_2-CO-N- \\ \\ CH_2-CO-OC_2H_5 \end{array}$	
30 387	$\begin{array}{c} OCH_3 \\ \\ -CH_2-CO-N- \\ \\ CH(CH_3)-CO-OCH_3 \end{array}$	
388	$\begin{array}{c} OCH_3 \\ \\ -CH_2-CO-N- \\ \\ CH(CH_3)-CO-OC_2H_5 \end{array}$	
35 389	$\begin{array}{c} OCH_3 \\ \\ -CH(CH_3)-CO-N- \\ \\ CH_2-CO-OCH_3 \end{array}$	
40 390	$\begin{array}{c} OCH_3 \\ \\ -CH(CH_3)-CO-N- \\ \\ CH_2-CO-OC_2H_5 \end{array}$	
391	$\begin{array}{c} OCH_3 \\ \\ -CH(CH_3)-CO-N- \\ \\ CH(CH_3)-CO-OCH_3 \end{array}$	
45 392	$\begin{array}{c} OCH_3 \\ \\ -CH(CH_3)-CO-N- \\ \\ CH(CH_3)-CO-OC_2H_5 \end{array}$	

Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5 393	$\text{---CH}_2\text{---C} \begin{array}{l} \text{= N---OCH}_3 \\ \text{OCH}_2\text{---CO---OCH}_3 \end{array}$	
10 394	$\text{---CH}_2\text{---C} \begin{array}{l} \text{= N---OCH}_3 \\ \text{OCH}_2\text{---CO---OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	
395	$\text{---CH}_2\text{---C} \begin{array}{l} \text{= N---OCH}_3 \\ \text{OCH(CH}_3\text{)---CO---OCH}_3 \end{array}$	
15 396	$\text{---CH}_2\text{---C} \begin{array}{l} \text{= N---OCH}_3 \\ \text{OCH(CH}_3\text{)---CO---OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	
20 397	$\text{---CH(CH}_3\text{)---C} \begin{array}{l} \text{= N---OCH}_3 \\ \text{OCH}_2\text{---CO---OCH}_3 \end{array}$	
398	$\text{---CH(CH}_3\text{)---C} \begin{array}{l} \text{= N---OCH}_3 \\ \text{OCH}_2\text{---CO---OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	
25 399	$\text{---CH(CH}_3\text{)---C} \begin{array}{l} \text{= N---OCH}_3 \\ \text{OCH(CH}_3\text{)---CO---OCH}_3 \end{array}$	
30 400	$\text{---CH(CH}_3\text{)---C} \begin{array}{l} \text{= N---OCH}_3 \\ \text{OCH(CH}_3\text{)---CO---OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	
401		
35 402		
403		

Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5 404		
10 405		
15 406		
20 407		
25 408		
30 419		
35 410		

Nr.	-R ⁸	Fp./ ¹ H-NMR (in CDCl ₃) [ppm]
5 411		
10 412		
15		

Tabelle 2



Nr.	X	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Fp. [°C]
25 451	CH ₂	H	H	Cl	H	H	56
452	C=O	H	H	Cl	H	H	Öl
453	CH-OH	H	H	Cl	H	H	Öl
30 454	CH-OCH ₃	H	H	Cl	H	H	Öl
455	CH-CN	H	H	Cl	H	H	Öl
456	CH-CO-NH ₂	H	H	Cl	H	H	136
457	CH-CO-OCH ₃	H	H	Cl	H	H	104
35 458	CH ₂	Cl	Cl	H	H	H	Öl
459	CH-CN	Cl	Cl	H	H	H	Öl
460	C=O	H	Br	OCH ₃	H	H	72
461	C=O	H	H	OCH ₂ -C≡CH	H	H	70
462	C=O	H	H	OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃	H	H	89
40 463	CH ₂	H	CF ₃	H	H	H	Öl
464	CH ₂	H	Cl	Cl	H	H	Öl
465	CH ₂	Cl	H	Cl	H	H	Öl
466	CH ₂	Cl	H	H	H	H	Öl
467	CH ₂	H	Cl	H	H	H	Öl
45 468	CH ₂	F	H	H	H	Cl	Öl
469	CH ₂	H	H	H	H	H	Öl

	Nr.	X	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Fp. [°C]
5	470	CH ₂	H	H	NO ₂	H	H	74
	471	CH ₂	H	H	NH ₂	H	H	73
	472	CH-CN	H	Cl	OCH ₃	H	H	100
	473	C=O	H	Cl	OCH ₃	H	H	83
	474	CH-OH	H	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	H	65
10	475	C=O	H	Cl	OCH(CH ₃)-C≡CH	H	H	95
	476	CH-CN	H	H	CN	H	H	Öl
	477	CH-CN	F	H	H	H	Cl	106
	478	C=O	H	Cl	H	H	H	Öl
	479	CH-CN	H	Cl	H	H	H	74
15	480	CH-CN	Cl	H	H	H	H	60
	481	CH-CN	O-CH ₃	H	H	H	H	58
	482	CH-CN	H	H	CH ₃	H	H	74
	483	CH-CN	Cl	H	Cl	H	H	85
	484	CH-CN	H	Cl	Cl	H	H	Öl
20	485	CH-CN	NO ₂	H	H	H	H	94
	486	CH-CN	H	H	H	H	H	72
	487	CH-CN	H	H	NO ₂	H	H	112
	488	CH-CN	H	CF ₃	H	H	H	Öl
	489	CH-CN	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	176
25	490	C=O	Cl	Cl	OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃	H	H	Öl
	491	CH ₂	H	H	CH ₃	H	H	40
	492	CH ₂	H	OH	H	H	H	83
	493	CH ₂	H	OCH ₃	H	H	H	Öl
	494	CH ₂	H	H	COOH	H	H	176
30	495	CH ₂	H	H	CO-OCH(CH ₃) ₂	H	H	74
	496	CH ₂	H	H	N(SO ₂ -CH ₃) ₂	H	H	Öl
	497	CH-Cl	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	134
	498	CH-Br	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	105
	499	CH-CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	107
35	500	CH ₂	Cl	H	NH-CO-CH ₃	OH	H	191
	501	CH ₂	H	H	H	COOH	H	125
	502	CH ₂	H	H	H	CO-OC ₂ H ₅	H	41
	503	CH ₂	H	H	NO ₂	COOH	H	264
	504	CH ₂	H	H	NO ₂	CO-OC ₂ H ₅	H	Öl
40	505	CH ₂	H	NO ₂	H	CO-OC ₂ H ₅	H	89
	506	CH ₂	H	H	NO ₂	OH	H	145
	507	CH ₂	NO ₂	H	H	OCH ₃	H	73
	508	CH ₂	H	OCH ₃	NO ₂	H	H	Öl
	509	CH ₂	NO ₂	H	NO ₂	OCH ₃	H	140
45	510	CH ₂	H	H	H	OCH ₃	NO ₂	101

Anwendungsbeispiele (herbizide Wirksamkeit)

Die herbizide Wirkung der substituierten 2-Benz(o)ylpyridine I ließ sich durch die folgenden Gewächshausversuche zeigen:

5

Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

- 10 Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen
- 15 waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

- Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je
- 20 nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige
- 25 Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 0,125, 0,0625, 0,0078 oder 0,0039 kg/ha a.S. (aktive Substanz).

- Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 - 25°C
- 30 bzw. 20 - 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

- 35 Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

- 40 Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

45

Lateinischer Name	Deutscher Name	Englischer Name
Glycine max	Sojabohnen	soybeans
Abutilon theophrasti	Chinesischer Hanf	velvet leaf

5

Lateinischer Name	Deutscher Name	Englischer Name
Solanum nigrum	Schwarzer Nachtschatten	black nightshade
Polygonum persicaria	Flohknöterich	ladysthumb
Veronica spec.	Ehrenpreisarten	speedwell

Bei Aufwandmengen von 7,8 und 3,9 g/ha a.S. zeigten die Verbindungen Nr. 118 und 369 im Nachauflaufverfahren sehr gute herbizide Wirkung gegen *Abutilon theophrasti*, *Solanum nigrum*, *Polygonum persicaria* und *Veronica spec.*

Die Verbindung Nr. 460 zeigte bei Aufwandmengen von 0,125 und 0,0625 kg/ha a.S. im Nachauflaufverfahren eine sehr gute selektive herbizide Wirkung gegen *Abutilon theophrasti*, *Solanum nigrum* und *Veronica spec.* in der Kultur Soja, die selbst nur wenig geschädigt wurde.

Anwendungsbeispiele (desikkant/defoliantische Wirksamkeit)

Als Testpflanzen dienten junge, 4-blättrige (ohne Keimblätter) Baumwollpflanzen, die unter Gewächshausbedingungen angezogen wurden (rel. Luftfeuchtigkeit 50 bis 70 %; Tag-/Nachttemperatur 27/20°C).

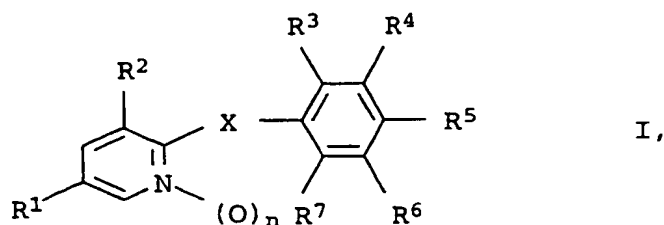
Die jungen Baumwollpflanzen wurden tropfnaß mit wässrigen Aufbereitungen der Wirkstoffe (unter Zusatz von 0,15 Gew.-% des Fettalkoholalkoxylats Plurafac® LF 700¹⁾, bezogen auf die Spritzbrühe) blattbehandelt. Die ausgebrachte Wassermenge betrug umgerechnet 1000 l/ha. Nach 13 Tagen wurde die Anzahl der abgeworfenen Blätter und der Grad der Entblätterung in % bestimmt.

Bei den unbehandelten Kontrollpflanzen trat kein Blattfall auf.

¹⁾ ein schaumarmes, nichtionisches Tensid der BASF AG

Patentansprüche

1. Substituierte 2-Benz(o)ylpyridine der allgemeinen Formel I



in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

n 0 oder 1;

X Carbonyl, Methylen, CH(C₁-C₄-Alkyl), CH-OH, CH-CN, CH-Halogen, C(Halogen)₂, CH-CONH₂, CH-CO-O(C₁-C₄-Alkyl), CH-O(C₁-C₄-Alkyl) oder C(CN)(C₁-C₄-Alkyl);

R¹ Halogen, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl;

R² Wasserstoff oder Halogen;

R³ Wasserstoff, Nitro, Hydroxy, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy;

R⁴ Wasserstoff, Nitro, Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy;

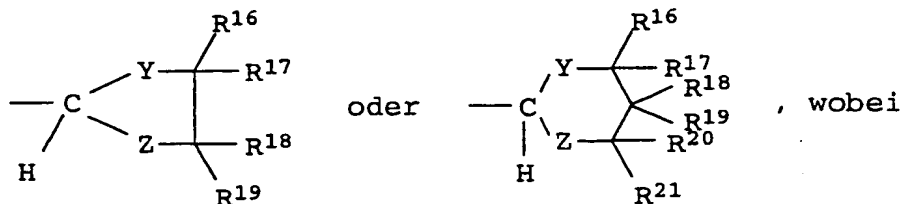
R⁵ Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₂-C₈-Halogenalkynyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-Alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-Alkynyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, Cyano-C₁-C₈-alkyl, Cyano-C₂-C₈-alkenyl, Cyano-C₃-C₈-alkynyl, -OR⁸, -SR⁸, -SO-R⁸, -SO₂-R⁸, -SO₂Cl, -N(R⁹, R¹⁰),

-NH-SO₂-(C₁-C₈-Alkyl), -N[-SO₂-(C₁-C₈-Alkyl)]₂, -N(C₁-C₈-Alkyl)[-SO₂-(C₁-C₈-Alkyl)], -SO₂-N(R⁹, R¹⁰), -N(R¹¹)-CO-R¹², -NH-CO-OR⁸, -O-CO-NH-R⁹, -O-CO-R¹², -NH-CO-NH-R⁹, -O-CS-NH₂, -O-CS-N(C₁-C₈-Alkyl)₂, -CO-OR⁸, -CO-N(R⁹, R¹⁰), -CS-N(R⁹, R¹⁰), -CO-NH-SO₂-(C₁-C₄-Alkyl), -CO-N(C₁-C₄-Alkyl)-SO₂-(C₁-C₄-Alkyl), -CO-R¹², Hydroxycarbonyl-C₁-C₈-alkyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl,

65

-CH₂-CH(Halogen)-CO-OR⁸, -CH₂-CH(Halogen)-CO-N(R⁹, R¹⁰),
 -CH₂-CH(Halogen)-CN, -CH₂-CH(Halogen)-CO-(C₁-C₄-Alkyl),
 -CH=C(Halogen)-CO-OR⁸, -CH=C(C₁-C₄-Alkyl)-CO-OR⁸,
 -CH=N-OR¹³, -C(R¹⁴)=N-OR¹³, -CH(-Y-R¹⁵, -Z-R¹⁵),
 -C(R¹⁴)(-Y-R¹⁵, -Z-R¹⁵),

5



10

R⁸ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl,
 C₁-C₈-Halogenalkyl, Cyano-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-
 C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkyl-
 sulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,
 C₃-C₈-Alkenyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, C₃-C₈-Halogenalkenyl,
 C₃-C₈-Alkinyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₃-C₈-Alkenyloxy)-
 carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₃-C₈-Alkinylloxy)carbonyl-C₁-C₆-
 alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 (C₁-C₈-Halogenalkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₃-C₈-Cyclo-
 alkyloxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-
 (C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₃-C₆-Alkenyloxy)-
 carbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 (C₃-C₆-Alkinylloxy)carbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-
 C₁-C₄-alkyl, Hydroxycarbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-
 C₁-C₄-alkyl, Oxetan-3-yloxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 Phenoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Benzyl oder Benzyloxy-
 carbonyl-C₁-C₄-alkyl, wobei die Phenylringe der 3 letzt-
 genannten Reste jeweils unsubstituiert sein oder ein bis
 drei Substituenten tragen können, jeweils ausgewählt aus
 der Gruppe bestehend aus Nitro, Cyano, Hydroxy, Hydroxy-
 carbonyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl,
 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl
 und (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkoxy;

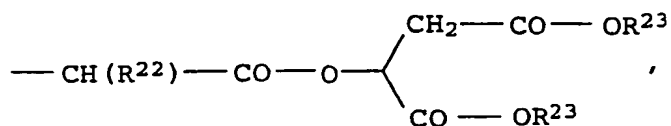
15

20

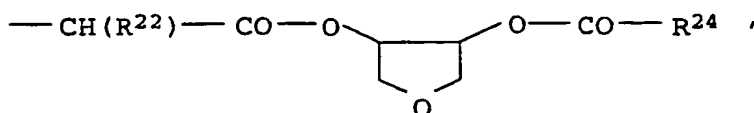
25

30

35



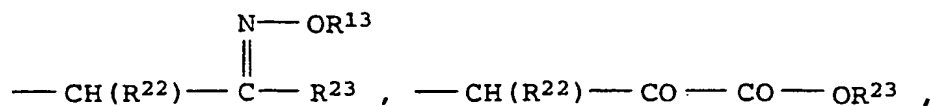
40



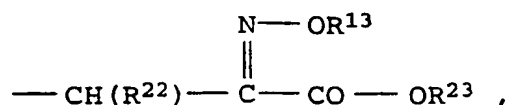
45

-CH(R²²)-CO-N(R⁹, R¹⁰), -CH(R²²)-CO-R²³,

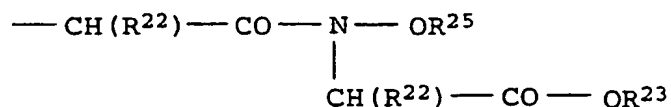
66



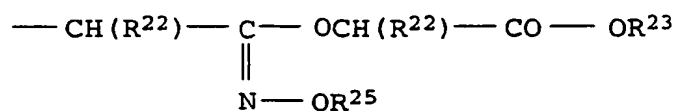
5



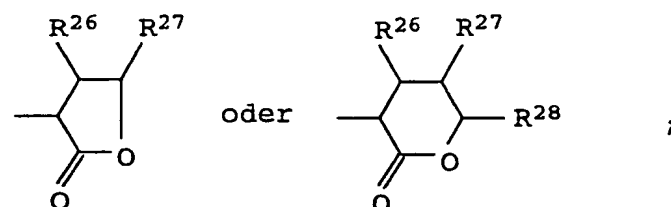
10



15



20



R⁹, R¹⁰ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkynyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, Cyano-C₁-C₈-alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₃-C₇-Cycloalkyloxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₃-C₇-cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl, wobei die Phenylringe der letzten beiden Reste unsubstituiert sein oder ein bis drei Substituenten tragen können, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Nitro, Cyano, Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl und (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkoxy

40

oder R⁹ und R¹⁰ zusammen für eine Tetramethylen-, Penta-methylen- oder Ethylenoxyethylenkette, die jeweils eine Hydroxycarbonylgruppe oder einen (C₁-C₆-Alkoxy)carbonylrest tragen kann;

45

R¹¹ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl oder C₃-C₈-Alkynyl;

67

- 5 R^{12}, R^{13} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_3 - C_8 -Alkenyl, C_3 - C_8 -Alkynyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, (C_1 - C_4 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, Phenyl oder Phenyl- C_1 - C_4 -alkyl, wobei die Phenylringe der letzten beiden Reste unsubstituiert sein oder ein bis drei Substituenten tragen können, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Nitro, Cyano, Hydroxy, Hydroxycarbonyl, Halogen, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy)carbonyl und (C_1 - C_4 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_4 -alkoxy;
- 10 R^{14} für C_1 - C_8 -Alkyl;
- 15 Y, Z unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel;
- R^{15} für C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl;
- 20 R^{16} - R^{21} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Cyano, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkoxy, Hydroxycarbonyl, (C_1 - C_8 -Alkoxy)carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1 - C_8 -Alkyl)-aminocarbonyl oder Di(C_1 - C_8 -alkyl)aminocarbonyl;
- 25 R^{22} - R^{25} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Alkenyl oder C_3 - C_8 -Alkynyl
- und
- 30 R^{26} - R^{28} unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C_1 - C_8 -Alkyl stehen;
- R^6 Wasserstoff, Nitro, Halogen, $-OR^{29}$ oder $-CO-OR^{29}$ und R^7 Wasserstoff, Nitro, Halogen oder $-OR^{30}$,
- 35 wobei R^{29} und R^{30} jeweils für eine der Bedeutungen von R^8 stehen,
- sowie die landwirtschaftlich brauchbaren Salze der Verbindungen I,
- 40 ausgenommen diejenigen Verbindungen I, bei denen X Methylen bedeutet, und
- R^5 für $-OR^8$ sowie R^3 und R^7 beide für Wasserstoff stehen oder
 - R^1 für Halogen sowie R^3 , R^4 , R^6 und R^7 alle gleichzeitig
- 45 für Wasserstoff stehen.

2. Substituierte 2-Benz(o)ylpyridine der Formel I nach Anspruch 1, wobei die Variablen folgende Bedeutungen haben:

n Null;

X Carbonyl oder Methylen;

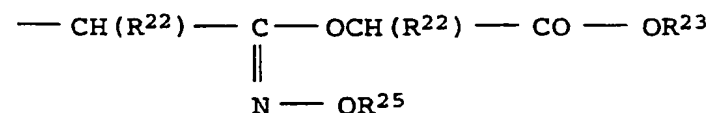
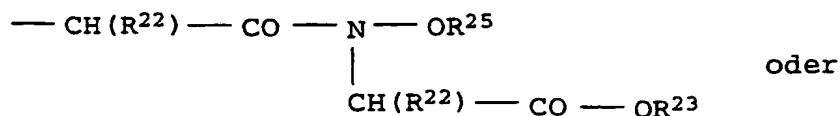
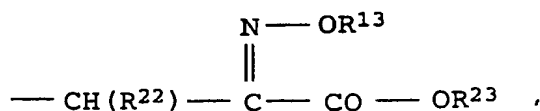
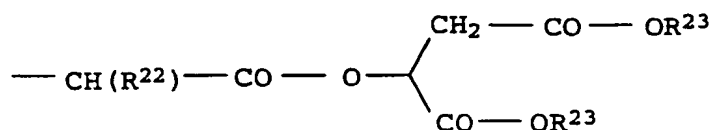
R¹ C₁-C₄-Halogenalkyl;

R², R³, R⁴ unabhängig voneinander Halogen;

R⁵ -OR⁸, -CO-OR⁸, -CO-N(R⁹, R¹⁰) oder -CH=N-OR¹³;

R⁶, R⁷ Wasserstoff oder Halogen;

R⁸ Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkynyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₃-C₈-Alkenyloxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, (C₃-C₈-Alkynyloxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)-carbonyl-(C₁-C₄-alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl,



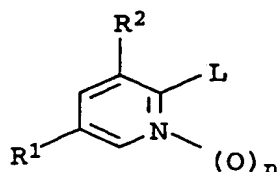
R⁹, R¹⁰ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl oder (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl;

R¹³ Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkynyl
oder (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl;

5 R²², R²³, R²⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl,
C₃-C₈-Alkenyl oder C₃-C₈-Alkynyl.

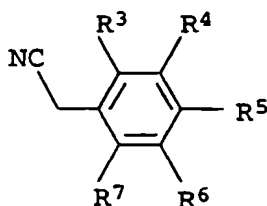
- 10 3. Verwendung der substituierten 2-Benz(o)ylpyridine der
Formel I und der landwirtschaftlich brauchbaren Salze von I,
gemäß Anspruch 1, als Herbizide oder zur Desikkation und/oder
Defoliation von Pflanzen.
- 15 4. Herbizides Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge
mindestens eines substituierten 2-Benz(o)ylpyridins der
Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von
I, gemäß Anspruch 1, und mindestens einen inerten flüssigen
und/oder festen Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens
einen oberflächenaktiven Stoff.
- 20 5. Mittel zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen,
enthaltend eine desikkant und/oder defoliant wirksame Menge
mindestens eines substituierten 2-Benz(o)ylpyridins der
Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von
I, gemäß Anspruch 1, und mindestens einen inerten flüssigen
und/oder festen Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens
25 einen oberflächenaktiven Stoff.
- 30 6. Verfahren zur Herstellung von herbizid wirksamen Mitteln,
dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge
mindestens eines substituierten 2-Benz(o)ylpyridins der
Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von
I, gemäß Anspruch 1, und mindestens einen inerten flüssigen
und/oder festen Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens
einen oberflächenaktiven Stoff mischt.
- 35 7. Verfahren zur Herstellung von desikkant und/oder defoliant
wirksamen Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man eine
desikkant und/oder defoliant wirksame Menge mindestens eines
substituierten 2-Benz(o)ylpyridins der Formel I oder eines
landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I, gemäß Anspruch
40 1, und mindestens einen inerten flüssigen und/oder festen
Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens einen ober-
flächenaktiven Stoff mischt.

8. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines substituierten 2-Benz(o)ylpyridins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I, gemäß Anspruch 1, auf Pflanzen, deren Lebensraum oder auf Saatgut einwirken läßt.
9. Verfahren zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man eine desikkant und/oder defoliant wirksame Menge mindestens eines substituierten 2-Benz(o)ylpyridins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I, gemäß Anspruch 1, auf Pflanzen einwirken läßt.
10. Verfahren nach Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, daß man Baumwolle behandelt.
11. Verfahren zur Herstellung von substituierten 2-Benz(o)ylpyridinen der Formel I gemäß Anspruch 1, bei denen X für Methylen oder CH-CN steht, dadurch gekennzeichnet, daß man substituierte Pyridine der Formel II



II

in Gegenwart einer Base mit Benzylnitrilen der Formel III



III

umsetzt und das Verfahrensprodukt I mit X = CH-CN gewünschtenfalls mittels wässriger Säure verseift und decarboxyliert.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inte PC	I Application No 98/01354
------------	------------------------------

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
 IPC 6 C07D213/61 A01N43/40

According to International Patent Classification(IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
 IPC 6 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 3 225 054 A (CUSIC J.W. & SAUSE H.W.) 21 December 1965 see column 3, line 9 - line 10 ---	1
X	KENNY M.T. ET AL.: "Antipicornavirus activity of some diarylmethanes and aralkylaminopyridines" ANTIVIRAL RESEARCH, vol. 7, no. 2, 1987, pages 87-97, XP002070894 see compounds 1-10 and 12-15 see page 90; table 1 --- -/--	1

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

° Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
 "E" earlier document but published on or after the international filing date
 "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
 "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
 "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
 "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
 "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
 "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

8 July 1998

Date of mailing of the international search report

27/07/1998

Name and mailing address of the ISA
 European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Hartrampf, G

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

onal Application No
/EP 98/01354

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>SLEEVI M.C. ET AL.: "Optical isomers of rocastine and close analogs: synthesis and H1 antihistaminic activity of its enantiomers and their structural relationship to the classical antihistamines"</p> <p>JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 34, no. 4 April 1991, pages 1314-1328, XP002070895 see scheme VI, compound 26 see page 1315</p>	1
X	<p>KONDO Y. ET AL.: "Preparation and reactions of 2-pyridyltellurium derivatives"</p> <p>JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, PERKIN TRANSACTIONS 1, no. 15, 1996, pages 1781-1782, XP002070896 see compound 9, page 1781</p>	1
X	<p>WO 96 33168 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. & IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) 24 October 1996 see page 49; examples VII-7, VII-8; table 33 see compounds of the formulas IV, XXX, XXXI, XXXIII, XXXIV, XXXVIII, XXXIX, XL, XLI, XLIV, XLV, XLVII, XLIX, L, LIII auf den pages 51, 69, 72, 74-79 and 81 see page 50; examples VIII-6, VIII-7; table 34 see compounds of the formulas VI, LI, LII on the pages 57 and 80</p>	1
P, X	<p>EP 0 778 264 A (F. HOFFMANN-LA ROCHE AG) 11 June 1997 see page 33, line 45 - line 49; example 42</p>	1
Y	<p>DE 29 48 095 A (HOECHST AG) 19 June 1981 cited in the application see claims 1, 3, 4</p>	1-11
Y	<p>EP 0 303 415 A (SUNTORY LIMITED & SHIONOGI SEIYAKU KABUSHIKI KAISHA) 15 February 1989 see claims 1, 8</p>	1-11
Y	<p>EP 0 461 079 A (SANDOZ LTD. ET AL.) 11 December 1991 cited in the application see claims 1, 7, 8</p>	1-11
	-/--	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
PCT/EP 98/01354

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 047 972 A (HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT) 24 March 1982 cited in the application see compounds of the formula 1 see claim 1 ---	1-11
A	CH 642 075 A (SIEGFRIED AKTIENGESELLSCHAFT) 30 March 1984 cited in the application see claims 1,2,5-7; example 4 -----	1-11

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

EP 98/01354

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 3225054	A	21-12-1965	NONE	
WO 9633168	A	24-10-1996	AU 5280098 A	19-03-1998
			AU 685025 B	08-01-1998
			AU 5346796 A	07-11-1996
			BR 9606328 A	18-11-1997
			CA 2193387 A	24-10-1996
			CN 1150797 A	28-05-1997
			CZ 9700155 A	16-04-1997
			EP 0766666 A	09-04-1997
			HU 9700159 A	28-01-1998
			JP 9003038 A	07-01-1997
			US 5728699 A	17-03-1998
EP 0778264	A	11-06-1997	CA 2190699 A	09-06-1997
			CN 1158844 A	10-09-1997
			JP 9221458 A	26-08-1997
DE 2948095	A	19-06-1981	NONE	
EP 303415	A	15-02-1989	JP 1175967 A	12-07-1989
			JP 2553122 B	13-11-1996
			JP 1042466 A	14-02-1989
			JP 2507461 B	12-06-1996
			JP 1042464 A	14-02-1989
			JP 2063807 C	24-06-1996
			JP 7096543 B	18-10-1995
			JP 1110648 A	27-04-1989
			JP 2566991 B	25-12-1996
			AT 114644 T	15-12-1994
			AU 616676 B	07-11-1991
			AU 2046988 A	16-02-1989
			CA 1257598 A	18-07-1989
			DE 3852235 D	12-01-1995
			DE 3852235 T	06-04-1995
			ES 2068830 T	01-05-1995
			GR 3015185 T	31-05-1995
			KR 9610789 B	08-08-1996
			US 4976773 A	11-12-1990
			US 5205855 A	27-04-1993

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

inform on patent family members

International Application No

PCT/JP 98/01354

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 461079	A	11-12-1991	AT 155466 T	15-08-1997
			AU 649448 B	26-05-1994
			AU 7820491 A	12-12-1991
			BG 61245 B	31-03-1997
			CA 2043976 A	08-12-1991
			CN 1057837 A,B	15-01-1992
			CS 9101737 A	15-01-1992
			DE 69126825 D	21-08-1997
			DE 69126825 T	19-02-1998
			DK 461079 T	09-02-1998
			EG 19649 A	30-09-1995
			ES 2107447 T	01-12-1997
			HR 930488 A	30-04-1996
			HU 212435 B	28-06-1996
			IL 98378 A	27-11-1995
			JP 4235967 A	25-08-1992
			PT 97890 A	31-03-1992
			SG 43838 A	14-11-1997
			SI 9111017 A	30-06-1997
			SK 278746 B	04-02-1998
			RU 2040522 C	25-07-1995
			TR 25270 A	01-01-1993
			US 5506192 A	09-04-1996
			US 5561101 A	01-10-1996
			US 5627137 A	06-05-1997
			US 5627138 A	06-05-1997
			PL 170729 B	31-01-1997
EP 47972	A	24-03-1982	DE 3034845 A	06-05-1982
			AU 547196 B	10-10-1985
			AU 7524781 A	25-03-1982
			BR 8105902 A	08-06-1982
			CA 1169262 A	19-06-1984
			OA 6899 A	30-04-1983
			US 4564381 A	14-01-1986
			ZA 8106386 A	29-09-1982
CH 642075	A	30-03-1984	NONE	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

ationales Aktenzeichen

/EP 98/01354

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 6 C07D213/61 A01N43/40

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 6 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 3 225 054 A (CUSIC J.W. & SAUSE H.W.) 21.Dezember 1965 siehe Spalte 3, Zeile 9 - Zeile 10 ---	1
X	KENNY M.T. ET AL.: "Antipicornavirus activity of some diarylmethanes and aralkylaminopyridines" ANTIVIRAL RESEARCH, Bd. 7, Nr. 2, 1987, Seiten 87-97, XP002070894 siehe Compounds 1-10 und 12-15 siehe Seite 90; Tabelle 1 --- -/--	1

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

8. Juli 1998

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

27/07/1998

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Hartrampf, G

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	SLEEVI M.C. ET AL.: "Optical isomers of rocastine and close analogs: synthesis and H1 antihistaminic activity of its enantiomers and their structural relationship to the classical antihistamines" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, Bd. 34, Nr. 4, April 1991, Seiten 1314-1328, XP002070895 siehe Scheme VI, Verbindung 26 siehe Seite 1315 ---	1
X	KONDO Y. ET AL.: "Preparation and reactions of 2-pyridyltellurium derivatives" JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, PERKIN TRANSACTIONS 1, Nr. 15, 1996, Seiten 1781-1782, XP002070896 siehe Verbindung 9, Seite 1781 ---	1
X	WO 96 33168 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. & IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) 24.Oktober 1996 siehe Seite 49; Beispiele VII-7,VII-8; Tabelle 33 siehe Verbindungen der Formeln IV,XXX,XXXI,XXXIII,XXXIV,XXXVIII,XXXIX,XL ,XLI,XLIV,XLV,XLVII,XLIX,L,LIII auf den Seiten 51,69,72,74-79 und 81 siehe Seite 50; Beispiele VIII-6,VIII-7; Tabelle 34 siehe Verbindungen der Formeln VI,LI,LII auf den Seiten 57 und 80 ---	1
P,X	EP 0 778 264 A (F. HOFFMANN-LA ROCHE AG) 11.Juni 1997 siehe Seite 33, Zeile 45 - Zeile 49; Beispiel 42 ---	1
Y	DE 29 48 095 A (HOECHST AG) 19.Juni 1981 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1,3,4 ---	1-11
Y	EP 0 303 415 A (SUNTORY LIMITED & SHIONOGI SEIYAKU KABUSHIKI KAISHA) 15.Februar 1989 ; siehe Ansprüche 1,8 ---	1-11
Y	EP 0 461 079 A (SANDOZ LTD. ET AL.) 11.Dezember 1991 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1,7,8 ---	1-11
	--- -/--	

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 047 972 A (HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT) 24.März 1982 in der Anmeldung erwähnt siehe Verbindungen der Formel I siehe Anspruch 1 ---	1-11
A	CH 642 075 A (SIEGFRIED AKTIENGESELLSCHAFT) 30.März 1984 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1,2,5-7; Beispiel 4 -----	1-11

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die, en Patentfamilie gehören

Inte les Aktenzeichen

PC 98/01354

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
US 3225054	A	21-12-1965	KEINE		
WO 9633168	A	24-10-1996	AU	5280098 A	19-03-1998
			AU	685025 B	08-01-1998
			AU	5346796 A	07-11-1996
			BR	9606328 A	18-11-1997
			CA	2193387 A	24-10-1996
			CN	1150797 A	28-05-1997
			CZ	9700155 A	16-04-1997
			EP	0766666 A	09-04-1997
			HU	9700159 A	28-01-1998
			JP	9003038 A	07-01-1997
			US	5728699 A	17-03-1998
EP 0778264	A	11-06-1997	CA	2190699 A	09-06-1997
			CN	1158844 A	10-09-1997
			JP	9221458 A	26-08-1997
DE 2948095	A	19-06-1981	KEINE		
EP 303415	A	15-02-1989	JP	1175967 A	12-07-1989
			JP	2553122 B	13-11-1996
			JP	1042466 A	14-02-1989
			JP	2507461 B	12-06-1996
			JP	1042464 A	14-02-1989
			JP	2063807 C	24-06-1996
			JP	7096543 B	18-10-1995
			JP	1110648 A	27-04-1989
			JP	2566991 B	25-12-1996
			AT	114644 T	15-12-1994
			AU	616676 B	07-11-1991
			AU	2046988 A	16-02-1989
			CA	1257598 A	18-07-1989
			DE	3852235 D	12-01-1995
			DE	3852235 T	06-04-1995
			ES	2068830 T	01-05-1995
			GR	3015185 T	31-05-1995
			KR	9610789 B	08-08-1996
			US	4976773 A	11-12-1990
			US	5205855 A	27-04-1993

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die derselben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

EP 98/01354

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 461079 A	11-12-1991	AT 155466 T	15-08-1997
		AU 649448 B	26-05-1994
		AU 7820491 A	12-12-1991
		BG 61245 B	31-03-1997
		CA 2043976 A	08-12-1991
		CN 1057837 A,B	15-01-1992
		CS 9101737 A	15-01-1992
		DE 69126825 D	21-08-1997
		DE 69126825 T	19-02-1998
		DK 461079 T	09-02-1998
		EG 19649 A	30-09-1995
		ES 2107447 T	01-12-1997
		HR 930488 A	30-04-1996
		HU 212435 B	28-06-1996
		IL 98378 A	27-11-1995
		JP 4235967 A	25-08-1992
		PT 97890 A	31-03-1992
		SG 43838 A	14-11-1997
		SI 9111017 A	30-06-1997
		SK 278746 B	04-02-1998
		RU 2040522 C	25-07-1995
		TR 25270 A	01-01-1993
		US 5506192 A	09-04-1996
		US 5561101 A	01-10-1996
		US 5627137 A	06-05-1997
		US 5627138 A	06-05-1997
		PL 170729 B	31-01-1997
EP 47972 A	24-03-1982	DE 3034845 A	06-05-1982
		AU 547196 B	10-10-1985
		AU 7524781 A	25-03-1982
		BR 8105902 A	08-06-1982
		CA 1169262 A	19-06-1984
		OA 6899 A	30-04-1983
		US 4564381 A	14-01-1986
		ZA 8106386 A	29-09-1982
CH 642075 A	30-03-1984	KEINE	